This Page Is Inserted by IFW Operations and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

As rescanning documents will not correct images, please do not report the images to the Image Problem Mailbox.

THIS PAGE BLANK USPTON

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM Internationales Büro



INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation 6:

C07D 307/54, 307/46, 333/24, 333/22, 263/32, 263/10, 261/08, 261/04, 277/30, 277/26, 271/06, A01N 43/08, 43/10, 43/28

A1

(11) Internationale Veröffentlichungsnummer:

(43) Internationales Veröffentlichungsdatum:

29. August 1996 (29.08.96)

WO 96/26200

(21) Internationales Aktenzeichen:

PCT/EP96/00593

(22) Internationales Anmeldedatum: 13. Februar 1996 (13.02.96)

(71) Anmelder (für alle Bestimmungsstaaten ausser US): BASF AK-TIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen

(30) Prioritätsdaten:

195 06 574.3

24. Februar 1995 (24.02.95) DE

ferstadt (DE). WALTER, Helmut [DE/DE]; Grünstadter Strasse 82, D-67283 Obrigheim (DE). WESTPHALEN, Karl-Otto [DE/DE]; Mausbergweg 58, D-67346 Speyer (DE). MISSLITZ, Ulf [DE/DE]; Am Herzel 40, D-67433 Neustadt (DE).

[DE/DE]; Sebastian-Kneipp-Strasse 17, D-67105 Schif-

(74) Gemeinsamer Vertreter: BASF AKTIENGESELLSCHAFT; D-67056 Ludwigshafen (DE).

(81) Bestimmungsstaaten: AU, BG, BR, CA, CN, CZ, EE, FI, GE, HU, JP, KR, LT, LV, MX, NO, NZ, PL, SG, SK, TR, UA, US, UZ, VN, eurasisches Patent (AZ, BY, KG, KZ, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE).

(72) Erfinder; und

(DE).

(75) Erfinder/Anmelder (nur für US): VON DEYN, Wolfgang [DE/DE]; Lüderitzstrasse 4, D-67434 Neustadt (DE). HILL, Regina, Luise [DE/DE]; Ziegelofenweg 40, D-67346 Speyer (DE). KARDORFF, Uwe [DE/DE]; D 3.4, D-68159 Mannheim (DE). ENGEL, Stefan [DE/DE]; Friedrich-Ebert-Strasse 13, D-65510 Idstein (DE). OTTEN, Martina [DE/DE]; Gunterstrasse 28, D-67069 Ludwigshafen (DE). VOSSEN, Marcus [DE/DE]; Wilhelm-Wundt-Strasse 7, D-68199 Mannheim (DE). PLATH, Peter [DE/DE]; Hans-Balcke-Strasse 13, D-67227 Frankenthal (DE). RANG, Harald [DE/DE]; Ziegeleistrasse 7, D-67122 Altrip (DE). HARREUS, Albrecht [DE/DE]; Beuthener Strasse 10, D-67063 Ludwigshafen (DE). RÖHL, Franz

Veröffentlicht

Mit internationalem Recherchenbericht.

(54) Title: HERBICIDAL BENZOYL DERIVATIVES

(54) Bezeichnung: HERBIZIDE BENZOYLDERIVATE

(57) Abstract

The invention concerns benzoyl derivatives of formula (I) in which the substituents have the following meanings: L and M represent hydrogen, C₁-C₆ alkyl, C₂-C₆ alkenyl, C2-C6 alkinyl, C1-C4 alkoxy (these groups being optionally substituted by one to five halogen atoms or C₁-C₄ alkoxy), halogen, cyano. nitro, $-(Y)_{n}-S(O)_{m}R^{7}$ -(Y)n-CO-R8 group; OI represents five 8 six-membered heterocyclic saturated or unsaturated group

containing one to three heteroatoms selected from the group comprising oxygen, sulphur and nitrogen and which can optionally be substituted by halogen, cyano, nitro, a -CO-R⁸ group, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkyl halide, C₃-C₈ cycloalkyl, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkoxy halide, C₁-C₄ alkyl thio, C₁-C₄ alkyl thio halide, di-C₁-C₄ alkyl amino, phenyl optionally substituted by halogen, cyano, nitro, C₁-C₄ alkyl halide, or an oxo group which can be present in the tautomeric form as a hydroxy group, is substituted or, together with a condensation-bound phenyl ring which is optionally substituted by halogen or, cyano, nitro, C₁-C₄ alkyl or C₁-C₄ alkyl halide, with a condensation-bound carbocycle or with a condensation-bound second heterocycle which can optionally be substituted by halogen, cyano, nitro, C₁-C₄ alkyl, di-C₁-C₄ alkyl amino, C₁-C₄ alkoxy, C₁-C₄ alkoxy halide or a C₁-C₄ alkyl halide, forms a bicyclic system; Y represents O or NR⁹; n is 0 or 1; m is 0, 1 or 2; R⁷ represents C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkyl halide or NR⁹R¹⁰; R⁸ represents C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkyl, C₁-C₄ alkyl, Q represents a cyclohexane-1,2-dione ring connected at position 2 and of formula (II) in which R¹, R², R⁴ and R⁶ represent hydrogen or C₁-C₄ alkyl, R⁵ represents hydrogen, C₁-C₄ alkyl, C₃-C₆ cycloalkyl, these groups optionally including one to three of the following substituents: halogen, C₁-C₄ alkyl thio, C₁-C₄ alkoxy, or R³ represents tetrahydropropanyl-3, tetrahydropropanyl-4 or tetrahydrothiopyranyl-3, or R³ and R⁵ together form a bond or a three to six-membered carbocyclic ring. The invention also concerns standard agricultural salts of compounds of formula (I) usually utilized in agriculture.

(57) Zusammenfassung

Benzoylderivate der Formel (I), in der die Substituenten folgende Bedeutungen haben: L, M Wasserstoff, C1-C6-Alkyl, C2-C6-Alkenyl, C2-C6-Alkinyl, C1-C4-Alkoxy, wobei diese Gruppen gegebenenfalls durch ein bis fünf Halogenatome oder C1-C4-Alkoxy substituiert sein können, Halogen, Cyano, Nitro, eine Gruppe -(Y)n-S(O)mR7 oder eine Gruppe -(Y)n-CO-R8, ein 5- oder 6-gliedriger heterocyclischer, gesättigter oder ungesättigter Rest, enthaltend ein bis drei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, der gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, eine Gruppe -CO-R8, C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C3-C8-Cycloalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogenalkoxy, C1-C4-Alkylthio, C1-C4-Halogenalkylthio, Di-C1-C4-Alkylamino, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C1-C4-Alkyl oder C1-C4-Halogenalkyl substituiertes Phenyl oder eine Oxogruppe, die gegebenenfalls auch in der tautomeren Form als Hydroxygruppe vorliegen kann, substituiert ist oder der mit einem ankondensierten, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenoalkyl substituierten Phenylring, einem ankondensierten Carbocyclus oder einem ankondensierten, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl, Di-C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituierten zweiten Heterocyclus ein bicyclisches System bildet; Y O, NR⁹; n null oder eins; m null, eins oder zwei; R7 C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl oder NR9R10; R8 C1-C4-Alkyl, C1-C4-Halogenalkyl, C1-C4-Alkoxy, oder NR9R10; R9 Wasserstoff oder C1-C4-Alkyl; R10 C1-C4-Alkyl; Q ein in 2-Stellung verknüpfter Cyclohexan-1,3-dionring der Formel (II), in welcher R1, R2, R4 und R6 Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl bedeuten, R⁵ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl oder eine Gruppe -COOR¹⁰ bedeutet, R³ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C3-C6-Cycloalkyl bedeutet, wobei diese Gruppen gegebenenfalls einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C1-C4-Alkylthio, oder C1-C4-Alkoxy, oder R3 Tetrahydropyranyl-3, Tetrahydropyranyl-4 oder Tetrahydrothiopyranyl-3 bedeutet, oder R3 und R⁵ gemeinsam eine Bindung oder einen drei- bis sechs-gliedrigen carbocyclischen Ring bilden, sowie landwirtschaftlich übliche Salze der Verbindungen (I).

LEDIGLICH ZUR INFORMATION

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäss dem PCT veröffentlichen.

AM	Armenien	GB	Vereinigtes Königreich	MX	Mexiko
AT	Österreich	GE	Georgien	NE	Niger
AU	Australien	GN	Guinea	NL	Niederlande
BB	Barbados	GR	Griechenland	NO	Norwegen
BE	Belgien	HU	Ungam	NZ	Neusecland
BF	Burkina Faso	IE	Irland	PL	Polen
BG	Bulgarien	IT	Italien	PT	Portugal
BJ	Benin	JP	Japan	RO	Rumanien
BR	Brasilien	KE	Kenya	RU	Russische Föderation
BY	Belarus	KG	Kirgisistan	SD	Sudan
CA	Kanada	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	SE	Schweden
CF	Zentrale Afrikanische Republik	KR	Republik Korea	SG	Singapur
CG	Kongo	KZ	Kasachstan	SI	Slowenien
СН	Schweiz	L	Liechtenstein	SK	Slowakei
CI	Côte d'Ivoire	LK	Sri Lanka	SN	Senegal
CM	Kamerun	LR	Liberia	SZ	Swasiland
CN	China	LK	Litauen	TD	Tschad
CS	Tschechoslowakei	LU	Luxemburg	TG	Togo
CZ	Tschechische Republik	LV	Lettland	TJ	Tadschikistan
DE	Deutschland	MC	Monaco	TT	Trinidad und Tobago
DK	Dinemark	MD	Republik Moldau	UA	Ukraine
EE	Estland	MG	Madagaskar	UG	Uganda
ES	Spanien	ML	Mali	US	Vereinigte Staaten von Amerika
FI	Finnland	MN	Mongolei	UZ	Usbekistan
FR	Frankreich	MR	Mauretanien	VN	Vietnam
GA	Gabon	MW	Malawi		

. .

Herbizide Benzoylderivate

Beschreibung

5

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Benzoylderivate mit herbizider Wirkung, Verfahren zur Herstellung der Benzoylderivate, Mittel welche diese enthalten sowie die Verwendung dieser Derivate oder sie enthaltender Mittel zur Unkrautbekämpfung.

10

Aus der Literatur sind herbizidwirksame 2-Aroylcyclohexandione bekannt, beispielsweise aus EP 90262, EP 135191, EP 186118, EP 186119, EP 186120, EP 319075, WO 9005712, JO 3052862 und JO 3120202.

15

Die herbiziden Eigenschaften der bekannten Verbindungen sowie die Verträglichkeit gegenüber Kulturpflanzen können jedoch nur bedingt befriedigen.

20 Die Aufgabe bestand darin neue 2-Aroylcyclohexandione mit verbesserten Eigenschaften zu finden.

Es wurden nun neue Benzoylderivate der Formel I gefunden

25

35

30 in der die Substituenten folgende Bedeutungen haben:

L,M Wasserstoff, C_1 - C_6 -Alkyl, C_2 - C_6 -Alkenyl, C_2 - C_6 -Alkinyl, C_1 - C_4 -Alkoxy, wobei diese Gruppen gegebenenfalls durch ein bis fünf Halogenatome oder C_1 - C_4 -Alkoxy substituiert sein können, Halogen, Cyano, Nitro, eine Gruppe -(Y)₀-S(O)_mR⁷ oder eine Gruppe -(Y)₀-CO-R⁸,

ein 5- oder 6-gliedriger heterocyclischer, gesättigter oder ungesättigter Rest, enthaltend ein bis drei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, der gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, eine Gruppe -CO-R⁸, C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₃-C₈-Cycloalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkylthio, Di-C₁-C₄-Alkylamino oder gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C₁-C₄-Alkyl oder C₁-C₄-Halogenalkyl substituiertes Phenyl oder eine Oxogruppe,

die gegebenenfalls auch in der tautomeren Form als Hydroxygruppe vorliegen kann, substituiert ist oder der mit einem ankondensierten durch Halogen, Cyano, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl oder C_2 - C_4 -Halogenalkyl substituierten Phenylring, einem ankondensierten Carbocyclus oder einem ankondensierten, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C_1 - C_4 -Alkyl,

- 5 Di-C:-C:-Alkylamino, C_1 -C₄-Alkoxy, C_1 -C₄-Halogenalkoxy, oder C_1 -C₄-Halogenalkyl substituierten zweiten Heterocyclus ein bicyclisches System bildet,
 - $Y = 0, NR^9,$
- 10 n null oder eins,
 - m null, eins oder zwei,
 - R^{3} C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder $NR^{9}R^{10}$,
 - R^8 C:-C₄-Alkyl, C:-C₄-Halogenalkyl, C:-C₄-Alkoxy, oder NR^9R^{10} ,
 - R9 Wasserstoff oder C:-C4-Alkyl,
- 15 R¹⁰ C₁-C₄-Alkyl,
 - Q ein in 2-Stellung verknüpfter Cyclohexan-1,3-dionring der Formel II,

25 in welcher

- R¹, R², R⁴ und R⁶ Wasserstoff oder C:-C4-Alkyl bedeuten,
- R^2 Wasserstoff, C_1 - C_4 -Alkyl oder eine Gruppe -COOR 10 bedeutet,
- R³ Wasserstoff, C₁-C₄-Alkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl bedeutet, wobei diese Gruppen gegebenenfalls einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C₁-C₄-Alkylthio, oder C₁-C₄-Alkoxy,

oder

35

R³ Tetrahydropyranyl-3, Tetrahydropyranyl-4 oder Tetrahydrothiopyranyl-3 bedeutet,

oder

40

 ${\rm R}^3$ und ${\rm R}^5$ gemeinsam eine Bindung oder einen drei- bis sechs- gliedrigen carbocyclischen Ring bilden,

sowie landwirtschaftlich übliche Salze der Verbindungen I.

Bevorzugt sind Benzoylderivate der Formel Ia

in der L für C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl,

10 C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen,
 Nitro oder Cyano und M für Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl,
 C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio,
 C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Halogenalkylthio,

15 C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro oder Cyano steht und Q und Z die oben angegebenen Bedeutungen haben.

Bevorzugt sind auch Benzoylderivate der Formel Ib

20

5

$$Q \xrightarrow{M} Z$$

$$L$$
Ib

25

in der L und M für C:-C6-Alkyl, C2-C6-Alkenyl, C2-C6-Alkinyl, C:-C4-Alkoxy, C:-C4-Alkylthio, C:-C4-Halogenalkyl, C:-C4-Halogenalkylthio, C:-C4-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro oder Cyano stehen und Q und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

Verbindungen der Formel Ic erhält man dadurch, daß man Verbindungen der Formel II mit einem Benzoesäurederivat der Formel III umsetzt und zu Benzoylderivaten der Formel Ic umlagert:

40

35

45

NSDOCID: <WO

Schema 1

25 In den oben genannten Formeln hat T die Bedeutung Halogen und L, M und Z die oben angegebene Bedeutung.

Der erste Schritt der Reaktionsabfolge, die Acylierung, erfolgt in allgemein bekannter Weise, z. B. durch Zugabe eines Säure-30 chlorids der Formel III (T=Cl) zur Lösung oder Suspension eines Cyclohexan-1,3-dions II in Gegenwart einer Hilfsbase. Die Reaktanden und die Hilfsbase werden dabei zweckmäßig in äquimolaren Mengen eingesetzt. Ein geringer Überschuß, z.B. 1,2 bis 1,5-Moläquivalente, bezogen auf II, der Hilfsbase kann u.U. vorteilhaft 35 sein.

Als Hilfsbase eignen sich tertiäre Alkylamine, Pyridin oder Alkalicarbonate. Als Lösungsmittel können z.B. Methylenchlcrid, Diethylether, Toluol oder Essigsäureethylester verwendet werden.

Während der Zugabe des Säurechlorids wird die Reaktionsmischung vorzugsweise auf 0 bis 10°C gekühlt, danach wird bei einer Temperatur von 20 bis 100°C, insbesondere 25 bis 50°C gerührt, bis die Umsetzung beendet ist. Die Aufarbeitung erfolgt in üblicher 45 Weise, z.B. wird das Reaktionsgemisch in Wasser gegossen und das Wertprodukt extrahiert, z.B. mit Methylenchlorid. Nach Trocknen der organischen Phase und Entfernung des Lösungsmittels kann der

rohe Enolester ohne weitere Reinigung zur Umlagerung eingesetzt werden. Herstellungsbeispiele für Benzoyl-enolester von Cyclohexan-1,3-dione findet man z. B. in EP-A 186 118 oder US 4,780,127.

5

Die Umlagerung der Enolester zu den Verbindungen der Formel Ic erfolgt zweckmäßig bei Temperaturen von 20°C bis 40°C in einem Lösungsmittel und in Gegenwart einer Hilfsbase sowie mit Hilfe einer Cyanoverbindung als Katalysator.

10

Als Lösungsmittel kann z.B. Acetonitril, Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, Essigsäureethylester oder Toluol verwendet werden. Bevorzugtes Lösungsmittel ist Acetonitril. Als Hilfsbase eignen sich tertiäre Alkylamine, Pyridin oder Alkalicarbonate, die vorzugsweise in äquimolarer Menge oder bis zu vierfachem

Überschuß, bezogen auf den Benzoylenolester, eingesetzt werden.
Bevorzugte Hilfsbase ist Triethylamin in doppelter Menge.

Als Katalysator eignen sich z.B. Kaliumcyanid oder Acetoncyanhy20 drin, vorzugsweise in einer Menge von 1 bis 50 Molprozent, bezogen
auf den Enolester. Bevorzugt setzt man Acetoncyanhydrin zu, z.B.
in der Menge von 5 bis 15, insbesondere 10 Molprozent. Beispiele
zur cyanidkatalysierten Umlagerung von Enolestern der Cyclohexan-1,3-dione findet man z.B. in EP-A 186 118 oder

25 US 4,780,127.

Die Aufarbeitung erfolgt in an sich bekannter Weise. Z.B. wird das Reaktionsgemisch mit verdünnten Mineralsäuren wie 5 %iger Salzsäure oder Schwefelsäure angesäuert und mit einem organischen

- 30 Lösungsmittel wie Methylenchlorid oder Essigsäureethylester extrahiert. Zur Reinigung wird der Extrakt mit kalter 5 bis 10 %iger Alkalicarbonatlösung extrahiert, wobei das Endprodukt in die wäßrige Phase übergeht. Durch Ansäuern der wäßrigen Lösung wird das Produkt der Formel IC ausgefällt oder erneut mit
- 35 Methylenchlorid extrahiert, getrocknet und anschließend vom Lösungsmittel befreit.

Die als Ausgangsmaterial verwendeten 1,3-Diketone der Formeln II sind bekannt und können nach an sich bekannten Verfahren herge-

40 stellt werden (vgl. EP-A 71 707, EP-A 142 741, EP-A 243 313, US 4 249 937 und WO 92/13821). Cyclohexandion-1,3 und Dimedon sind käufliche Verbindungen.

Benzoesäurederivate der Formel III lassen sich folgendermaßen 45 herstellen:

Benzoylhalogenide wie beispielsweise Benzoylchloride der Formel III (T=Cl) werden in an sich bekannter Weise durch Umsetzung der Benzoesäuren der Formel III (T=OH) mit Thionylchlorid hergestellt.

Die Benzoesäuren der Formel III (T=OH) können in bekannter Weise durch saure oder basische Hydrolyse aus den entsprechenden Estern der Formel III ($T=C_1-C_4-Alkoxy$) hergestellt werden.

10 Die Zwischenprodukte der Formel III lassen sich z.B. gemäß Schema 2 und 3 auf den im folgenden beschriebenen Wegen darstellen.

Schema 2

20 IV
$$V$$
 III

T $C \cdot -C_{\zeta}$ -Alkoxy,

X C1, Br, J, $-OS(O)_2CF_3$, $-OS(O)_2F$

Sn(C:-C4-Alkyl)3, B(OH)2, ZnHal, wobei Hal für Cl oder Br steht

L, M, Z wie oben definiert.

Danach lassen sich die Arylhalogenverbindungen oder Arylsulfonate IV in an sich bekannter Weise mit Heteroarylstannaten (Stille30 Kupplungen), Heteroaryl-Borverbindungen (Suzuki-Kupplungen) oder Heteroaryl-Zinkverbindungen (Negishi-Reaktion) V (vgl. z.B. Syn-

Heteroaryl-Zinkverbindungen (Negishi-Reaktion) V (vgl. z.B. Synthesis 1987, 51-53, Synthesis 1992, 413) in Gegenwart eines Palladium- oder Nickel-Übergangsmetallkatalysators und gegebenenfalls einer Base zu den neuen Verbindungen der allgemeinen Formel III umsetzen.

Die Benzoesäurederivate der Formel III können auch erhalten werden, indem man entsprechende brom- oder iodsubstituierte Verbindungen der Formel VI

40

Schema 3

10

Z oder CN \mathbf{Z}^{1}

OH, Ci-C4-Alkoxy Т

in der L und M die obengenannte Bedeutung haben, in Gegenwart 15 eines Palladium-, Nickel-, Cobalt- oder Rhodium-Übergangsmetallkatalysators und einer Base mit Kohlenmonoxid und Wasser unter erhöhtem Druck umsetzt.

Bevorzugt im Rahmen der vorliegenden Erfindung sind Benzoylderi-20 vate der Formel IIIa

25

in der T, L, M und Z die folgende Bedeutung haben:

Chlor, OH oder C:-C4-Alkoxy 30 T

 $C_1-C_6-Alkyl$, $C_2-C_6-Alkenyl$, $C_2-C_6-Alkinyl$, $C_1-C_4-Alkoxy$, L $C_1-C_4-Alkylthio$, $C_1-C_2-Halogenalkyl$, $C_1-C_4-Halogenalkoxy$, $C_1-C_4-Halogenalkylthio, C_1-C_4-Alkylsuflonyl, Halogen, Nitro$ oder Cyano

 $C_1-C_6-Alkyl$, $C_2-C_6-Alkenyl$, $C_2-C_6-Alkinyl$, $C_1-C_4-Alkoxy$, 35 M $C_1-C_4-Alkylthio$, $C_1-C_4-Halogenalkyl$, $C_1-C_4-Halogenalkoxy$, $C_1-C_4-Halogenalkylthio$, $C_1-C_4-Alkylsulfonyl$, Halogen, Nitro oder Cyano

wie oben angegeben. Z

8

Bevorzugt sind auch Benzoylderivate der Formel IIIb

in der T,L,M und Z die folgende Bedeutung haben:

10 T Chlor, OH oder C:-C4-Alkoxy

L,M C_1-C_6 -Alkyl, C_2-C_6 -Alkenyl, C_2-C_6 -Alkinyl, C_1-C_4 -Alkoxy, C_1-C_4 -Alkylthio, C_1-C_4 -Halogenalkyl, C_1-C_4 -Halogenalkylthio, C_1-C_4 -Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro oder Cyano

15 Z wie oben angegeben.

Die Katalysatoren Nickel, Cobalt, Rhodium und insbesondere Palladium können metallisch oder in Form üblicher Salze wie in Form von Halogenverbindungen, z.B. $PdCl_2$, $RhCl_3 \cdot H_2O$, Acetaten,

- 20 z.B. Pd(OAc)₂, Cyaniden usw. in den bekannten Wertigkeitsstufen vorliegen. Ferner können Metallkomplexe mit tertiären Phosphinen, Metallalkylcarbonyle, Metallcarbonyle, z.B. CO₂(CO)₈, Ni(CO)₁, Metallcarbonyl-Komplexe mit tertiären Phosphinen, z.B.
- (PPh₃)₂Ni(CO)₂, oder mit tertiären Phosphinen komplexierte Über-25 gangsmetallsalze vorliegen. Die letztgenannte Ausführungsform ist insbesondere im Fall von Palladium als Katalysator bevorzugt. Dabei ist die Art der Phosphinliganden breit variabel. Beispielsweise lassen sie sich durch folgende Formeln wiedergeben:

30
$$P = \begin{cases} R^{11} \\ R^{12} \end{cases}$$
 oder $\begin{cases} R^{11} \\ R^{12} \end{cases} P = (CH_2)_n = P \begin{cases} R^{13} \\ R^{14} \end{cases}$

wobei n die Zahlen 1, 2, 3 oder 4 bedeutet und die Reste Ribis R^{14} für niedermolekulares Alkyl, z.B. C_1 - C_6 -Alkyl, Aryl,

- 35 C:-C4-Alkylaryl, z.B. Benzyl, Phenethyl oder Aryloxy stehem. Aryl ist z.B. Naphthyl, Anthryl und vorzugsweise gegebenenfalls substituiertes Phenyl, wobei man hinsichtlich der Substituentem nur auf deren Inertheit gegenüber der Carboxylierungsreaktion zu achten hat, ansonsten können sie breit variiert werden und umfassen
- 40 alle inerten C-organischen Reste wie C_1 - C_6 -Alkylreste, z.B. Methyl, Carboxylreste wie COOH, COOM (M ist z.B. ein Alkali-, Erdalkalimetall oder Ammoniumsalz), oder C-organische Reste über Sauerstoff gebunden wie C_1 - C_6 -Alkoxyreste.
- **45** Die Herstellung der Phosphinkomplexe kann in an sich bekannter Weise, z.B. wie in den eingangs genannten Dokumenten beschrieben, erfolgen. Beispielsweise geht man von üblichen kommerziell

WO 96/26200 PCT/EP96/00593

9

erwerblichen Metallsalzen wie $PdCl_2$ oder $Pd(OCOCH_3)_2$ aus und fügt das Phosphin z.B. $P(C_6H_5)_3$, $P(n-C_4H_9)_3$, $PCH_3(C_6H_5)_2$, 1,2-Bis(diphenylphosphino)ethan hinzu.

5 Die Menge an Phosphin, bezogen auf das Übergangsmetall, beträgt üblicherweise 0 bis 20, insbesondere 0,1 bis 10 Moläquivalente, besonders bevorzugt 1 bis 5 Moläquivalente.

Die Menge an Übergangsmetall ist nicht kritisch. Natürlich wird 10 man aus Kostengründen eher eine geringe Menge, z.B. von 0,1 bis 10 Mol.-%, insbesondere 1 bis 5 Mol.-%, bezogen auf den Ausgangsstoff II bzw. III verwenden.

Zur Herstellung der Benzoesäuren III (T = OH) führt man die

15 Umsetzung mit Kohlenmonoxid und mindestens äquimolaren Mengen
an Wasser, bezogen auf die Ausgangsstoffe VI durch. Der Reaktionspartner Wasser kann gleichzeitig auch als Lösungsmittel dienen, d.h. die maximale Menge ist nicht kritisch.

- 20 Es kann aber auch je nach Art der Ausgangsstoffe und der verwendeten Katalysatoren von Vorteil sein, anstelle des Reaktionspartners ein anderes inertes Lösungsmittel oder die für die Carboxylierung verwendete Base als Lösungsmittel zu verwenden.
- 25 Als inerte Lösungsmittel kommen für Carboxylierungsreaktionen übliche Lösungsmittel wie Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Hexan, Pentan, Cyclohexan, Ether z.B. Methyl-tert.butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Dimethoxyethan, substituierte Amide wie Dimethylformamid, persubstituierte Harnstoffe wie
- 30 Tetra-C₁-C₄-alkylharnstoffe oder Nitrile wie Benzonitril oder Acetonitril in Betracht.

In einer bevorzugten Ausführungsform des Verfahrens verwendet man einen der Reaktionspartner, insbesondere die Base, im Überschuß, 35 so daß kein zusätzliches Lösungsmittel erforderlich ist.

Für das Verfahren geeignete Basen sind alle inerten Basen, die den bei der Umsetzung freiwerdenden Jodwasserstoff bzw. Bromwasserstoff zu binden vermögen. Beispielsweise sind hier tertiäre

40 Amine wie tert.-Alkylamine, z.B. Trialkylamine wie Triethylamin, cyclische Amine wie N-Methylpiperidin oder N,N'-Dimethylpiperazin, Pyridin, Alkali- oder -hydrogencarbonate, oder tetra-alkylsubstituierte Harnstoffderivate wie Tetra-C1-C4-alkylharnstoff, z.B. Tetramethylharnstoff, zu nennen.

Die Menge an Base ist nicht kritisch, üblicherweise werden 1 bis 10, insbesondere 1 bis 5 Mol verwendet. Bei gleichzeitiger Verwendung der Base als Lösungsmittel, wird die Menge in der Regel so bemessen, daß die Reaktionspartner gelöst sind, wobei man aus Praktikabilitätsgründen unnötig hohe Überschüsse vermeidet, um Kosten zu sparen, kleine Reaktionsgefäße einsetzen zu können und den Reaktionspartnern maximalen Kontakt zu gewährleisten.

Während der Umsetzung wird der Kohlenmonoxiddruck so eingestellt, 10 daß immer ein Überschuß an CO, bezogen auf VI vorliegt. Vorzugsweise liegt der Kohlenmonoxiddruck bei Raumtemperatur bei 1 bis 250 bar, insbesondere 5 bis 150 bar CO.

Die Carbonylierung wird in der Regel bei Temperaturen von 20 bis 250°C, insbesondere bei 30 bis 150°C kontinuierlich oder diskontinuierlich durchgeführt. Bei diskontinuierlichem Betrieb wird zweckmäßigerweise zur Aufrechterhaltung eines konstanten Druckes kontinuierlich Kohlenmonoxid auf das Umsetzungsgemisch aufgepreßt.

Die als Ausgangsverbindungen benutzten Arylhalogenverbindungen VI sind bekannt oder können leicht durch geeignete Kombination bekannter Synthesen hergestellt werden.

25 Beispielsweise können die Halogenverbindungen VI durch Sandmeyer-Reaktion aus entsprechenden Anilinen erhalten werden, die ihrerseits durch Reduktion von geeigneten Nitroverbindungen (vgl. z.B. für VI mit Z: = CN: Liebigs Ann. Chem. 1980, 768-778) synthetisiert werden. Die Arylbromide VI können außerdem durch direkte

30 Bromierung geeigneter Ausgangsverbindungen erhalten werden [vgl. z.B. Monatsh. Chem. 99, 815-822 (1968)].

35

40

Schema 4

T C:-C4-Alkoxy

25 X Cl, Br, J, -OS(O)₂CF₃, -OS(O)₂F

L,M,Z wie oben definiert

R:5 Wasserstoff, C:-C4-Alkyl, C:-C4-Halogenalkyl, C3-C9-Cyclo-alkyl, ggf. subst. Phenyl oder Trimethylsilyl,

R:6 Wasserstoff, C:-C4-Halogenalkyl, C3-C8-Cycloalkyl oder

ggf. subst. Phenyl.

Ausgehend von den Arylhalogenverbindungen oder Arylsulfonaten IV lassen sich in Gegenwart eines Palladium- oder Nickel-Übergangsmetallkatalysators und gegebenenfalls einer Base Arylmethylke35 tone IVa nach literaturbekannten Verfahren durch Umsetzung mit Vinylalkylethern und anschließende Hydrolyse herstellen [vgl. z.B. Tetrahedron Lett. 32, 1753-1756 (1991)].

Die ethinylierten Aromaten IVb können in an sich bekannter Weise durch Umsetzung von Arylhalogenverbindungen oder Arylsulfonaten IV mit substituierten Acetylenen in Gegenwart eines Palladiumoder Nickel-Übergangsmetallkatalysators hergestellt werden (z.B. Heterocycles, 24, 31-32 (1986)). Derivate IVb mit R¹⁵= H erhält man zweckmäßigerweise aus den Silylverbindungen IVb, R¹⁵= -Si(CH₃)₃ [J.Org.Chem. 46, 2280-2286 (1981)].

Durch Heck-Reaktion von Arylhalogenverbindungen oder Arylsulfonaten IV mit Olefinen in Gegenwart eines Palladiumkatalysators werden die Arylalkene IVc erhalten (vgl. z.B. Heck, Palladium Reagents in Organic Synthesis, Academic Pres, London 1985 bzw. Syn-5 thesis 1993, 735-762).

7

Die als Ausgangsverbindungen benutzten Benzoylderivate IV sind bekannt [vgl. z.B.Coll. Czech. Chem. Commn. 40, 3009-3019 (1975)] oder können leicht durch geeignete Kombination bekannter 10 Synthesen hergestellt werden.

Beispielsweise können die Sulfonate IV $(X = -OS(0)_2CF_3, -OS(0)_2F)$ aus den entsprechenden Phenolen, die ihrerseits bekannt sind (vgl. z.B. EP 195247) oder nach bekannten Methoden hergestellt 15 werden können, erhalten werden (vgl. z.B. Synthesis 1993, 735-762).

Die Halogenverbindungen IV (X = Cl, Br oder I) können beispielsweise durch Sandmeyer-Reaktion aus entsprechenden Anilinen erhal-20 ten werden.

Schema 5

S, NH oder NOH A

T ist C:-C:-Alkoxy und L, M wie oben definiert.

Isophthalsäurederivate IVf können aus den Aldehyden IVe nach bekannten Verfahren hergestellt werden [s. J. March Advanced

5 Organic Chemistry 3. Aufl., S. 629ff, Wiley-Interscience Publication (1985)].

Die Oxime IVg erhält man vorteilhaft dadurch, daß man in an sich bekannter Weise Aldehyde IVe mit Hydroxylamin umsetzt [s. J.

10 March Advanced Organic Chemistry 3. Aufl., S. 805-806, Wiley-Interscience Publication (1985)].

Die Umwandlung der Oxime IVg in Nitrile IVh kann ebenfalls nach an sich bekannten Verfahren erfolgen (s. J. March Advanced

15 Organic Chemistry 3. Aufl., S. 931-932, Wiley-Interscience Publication (1985)].

Die als Ausgangsverbindungen benötigten Aldehyde IVe sind bekannt oder nach bekannten Methoden herstellbar. Beispielsweise können 20 sie gemäß Schema 6 aus den Methylverbindungen VII synthetisiert

Schema 6

RNSDOCID: >WO GESESONAT I >

25
$$T \xrightarrow{\text{CH}_{2}\text{Br}} T \xrightarrow{\text{CH}_{2}\text{Br}} T \xrightarrow{\text{IVe}} H$$

$$VIII \qquad VIII \qquad IVe$$

Die Reste T, M und L haben die unter Schema 5 genannte Bedeutung. Die Methylverbindungen VII können nach allgemein bekannten Metho35 den, beispielsweise mit N-Bromsuccinimid oder 1,3-Dibrom-5,5-dimethylhydantoin, zu den Benzylbromiden VIII umgesetzt werden. Die Umsetzung von Benzylbromiden zu Benzaldehyden IVe ist ebenfalls literaturbekannt [vgl. Synth. Commun. 22 1967-1971 (1992)].

40 Die Vorprodukte IVa bis IVh eignen sich zum Aufbau heterocyclischer Zwischenprodukte III.

Beispielsweise können aus den Acetophenonen IVa über die halogenierte Zwischenstufe IVd 5-Oxazolyl-[vgl. z.B. J. Hetero-cyclic Chem., 28, 17-28 (1991)] oder 4-Thiazolyl-derivate [vgl.

WO 96/26200 PCT/EP96/00593

14

z.B. Metzger, Thiazoles in: The Chemistry of heterocyclic compounds, Vol.34 S. 175ff (1976)] erhalten werden.

Die Acetylene IVb bzw. die Alkene IVc eignen sich zum Aufbau von 5 4-Isoxazolyl-, 5-Isoxazolyl-, 4,5-Dihydroisoxazol-4-yl-, 4,5-Dihydroisoxazol-5-yl-derivaten [vgl. z.B. Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, 4. Aufl., Bd. X/3, S. 843ff (1965)].

Aus den Benzoesäuren IVf bzw. den daraus nach Standardverfahren erhältlichen Säurechloriden IVi können beispielsweise nach literaturbekannten Verfahren 2-Oxazolyl-, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl-, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl-derivate [vgl. z.B. J. Heterocyclic Chem., 28, 17-28 (1991)] oder 2-Pyrrolyl-derivate [vgl. z.B. Heterocycles 26, 3141-3151 (1987)] hergestellt werden.

15

- 1,2,4-Triazol-3-yl-derivate sind aus Benzonitrilen IVh nach bekannten Methoden [vgl. z.B. J. Chem. Soc. 3461-3464 (1954)] herzustellen.
- 20 Die Benzonitrile IVh können über die Zwischenstufe der Thioamide, Amidoxime oder Amdine IVm in 1,2,4-Oxadiazol-3-yl- [vgl. z.B. J. Heterocyclic Chem., 28, 17-28 (1991)] 2-Thiazolyl-, 4,5-Dihydrothiazol-2-yl- oder 5,6-Dihydro-4-H-1,3-thiazin-2-yl-derivate [vgl. z.B. Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, 4.
- 25 Aufl., Bd. E5, S. 1268ff (1985)] umgewandelt werden. Aus den Thioamiden IVm (A=S) sind nach literaturbekannten Verfahren auch 1,2,4-Thiadiazol-5-yl-derivate [vgl. z.B. J.Org.Chem. 45 3750-3753 (1980)] oder 1,3,4-Thiadiazol-2-yl-derivate [vgl. z.B. J. Chem.Soc., Perkin Trans. I 1987-1991 (1982)] erhältlich.

30

Die Umwandlung von Oximen IVg in 3-Isoxazolyl-derivate kann in an sich bekannter Weise über die Zwischenstufe der Hydroxamsäure-chloride IVk erfolgen [vgl. z.B. Houben-Weyl, Methoden der organischen Chemie, 4. Aufl., Bd. X/3, S. 843ff (1965)].

35

Im Hinblick auf die bestimmungsgemäße Verwendung der Benzoylderivate der allgemeinen Formel I kommen als Substituenten folgende Reste in Betracht:

40 L,M Wasserstoff,

- C:-C6-Alkyl wie Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl, 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl, Pentyl, 1-Methylbutyl, 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 1,1-Dimethylpropyl,
- 45 1,2-Dimethylpropyl, 2,2-Dimethylpropyl, 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl, 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl, 1,3-Dimethylbutyl,

```
15
2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl, 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethyl-
butyl, 1,1,2-Trimethylpropyl, 1,2,2-Trimethylpropyl,
1-Ethyl-1-methylpropyl oder 1-Ethyl-2-methyl-propyl,

5 insbesondere Methyl, Ethyl, 1-Methylethyl, 1-Methylpropyl,
2-Methylpropyl, 1,1-Dimethylethyl und 1,1-Dimethylpropyl;

C2-C6-Alkenyl wie 2-Propenyl, 2-Butenyl, 3-Butenyl,
1-Methyl-2-propenyl, 2-Methyl-2-propenyl, 2-Pentenyl, 3-Pentenyl,
4-Pentenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl,
```

10 4-Pentenyl, 3-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-2-butenyl,
2-Methyl-2-butenyl, 1-Methyl-3-butenyl, 2-Methyl-4-butenyl,
3-Methyl-3 butenyl, 1,1-Dimethyl-2-propenyl,1,2-Dimethyl2-propenyl, 1-Ethyl-2-propenyl, 2-Hexenyl, 3-Hexenyl, 4-Hexenyl,
5-Hexenyl, 1-Methyl-2-pentenyl, 2-Methyl-2-pentenyl,

3-Methyl-2-pentenyl, 4-Methyl-2-pentenyl, 1-Methyl-3 pentenyl, 2-Methyl-3-pentenyl, 3-Methyl-3-pentenyl, 4-Methyl-3-pentenyl, 1-Methyl-4-pentenyl, 2-Methyl-4-pentenyl, 3-Methyl-4-pentenyl, 4-Methyl-4-pentenyl, 1,1-Dimethyl-2-butenyl, 1,1-Dimethyl-3-butenyl, 1,2-Dimethyl-2-butenyl,

20 1,3-Dimethyl-3-butenyl, 2,2-Dimethyl-3-butenyl,
2,3-Dimethyl-2-butenyl, 2,3-Dimethyl-3-butenyl,
1-Ethyl-2-butenyl, 1-Ethyl-3 butenyl, 2-Ethyl-2-butenyl,
2-Ethyl-3-butenyl, 1,1,2-Trimethyl-2-propenyl,

1-Ethyl-1-methyl-2-propenyl und Ethyl-2-methyl-2-propenyl, 25

insbesondere 1-Methyl-2-propenyl, 1-Methyl-2-butenyl,
1,1-Dimethyl-2-propenyl und 1,1-Dimethyl-2-butenyl;

C₂-C₆-Alkinyl wie Propargyl, 2-Butinyl, 3-Butenyl, 2-Pentinyl,

30 3-Pentinyl, 4-Pentinyl, 1-Methyl-3-butinyl, 2-Methyl-3-butinyl,

1-Methyl-2-butinyl, 1,1-Dimethyl-2 propinyl, 1-Ethyl-2-propinyl,

2-Hexinyl, 3-Hexinyl, 4-Hexinyl, 5-Hexinyl, 1-Methyl-2-pentinyl,

1-Methyl-3-pentinyl, 1-Methyl-4-pentinyl, 3-Methyl-4-pentinyl,

4-Methyl-2-pentinyl, 1,1-Dimethyl-2-butinyl,

35 1,1-Dimethyl-3-butinyl, 1,2-Dimethyl-3-butinyl, 2,2-Dimethyl-3-butinyl, 1-Ethyl-2-butinyl, 1-Ethyl-3-butinyl, 2-Ethyl-3-butinyl und 1-Ethyl-1-methyl-2-propinyl;

C:-C4-Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy, n-Propoxy, 1-Methylethoxy, n-Bu-40 toxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy und 1,1-Dimethylethoxy,

insbesondere C_1 - C_3 -Alkoxy wie Methoxy, Ethoxy, i-Propoxy,

wobei diese Gruppen gegebenenfalls durch ein bis fünf Halogenatome wie Fluor, Chlor, Brom und Iod, vorzugsweise Fluor und Chlor oder C_1 - C_4 -Alkoxy wie vorstehend genannt substituiert sein können.

Die vorstehend definierte Gruppe $-(Y)_n-S(0)-R^7$ steht beispielsweise für

C₁-C₄-Alkylthio wie Methylthio, Ethylthio, n-Propylthio, l-Methyl10 ethylthio, n-Butylthio, l-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio
und l,l-Dimethylethylthio, insbesondere Methylthio;

C:-C:-Alkylsulfinyl wie Methylsulfinyl, Ethylsulfinyl, n-Propyl-sulfinyl, 1-Methylethylsulfinyl, n-Butylsulfinyl, 1-Methylpropyl-sulfinyl, 2-Methylpropylsulfinyl und 1,1-Dimethylethylsulfinyl, insbesondere Methylsulfinyl;

C:-C4-Alkylsulfonyl wie Methylsulfonyl, Ethylsulfonyl, n-Propyl-sulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl, n-Butylsulfonyl, 1-Methylpropyl-sulfonyl, 2-Methylpropylsulfonyl und 1,1-Dimethylethylsulfonyl, insbesondere Methylsulfonyl;

C:-C4-Alkoxysulfonyl wie Methoxysulfonyl, Ethoxysulfonyl, n-Propoxysulfonyl, 1-Methylethoxysulfonyl, n-Butoxysulfonyl, 1-Methyl-25 propoxysulfonyl, 2-Methylpropoxysulfonyl und 1,1-Dimethylethoxysulfonyl, insbesondere Methoxysulfonyl;

N-C:-C4-Alkylsulfamoyl wie N-Methylsulfamoyl, N-Ethylsulfamoyl, N-n-Propylsulfamoyl, N-1-Methylethylsulfamoyl, N-n-Butylsulfa30 moyl, N-1-Methylpropylsulfamoyl, N-2-Methylpropylsulfamoyl und N-1,1-Dimethylethylsulfamoyl, insbesondere N-Methylsulfamoyl; N-C:-C4-Alkylsulfinamoyl wie N-Methylsulfinamoyl, N-Ethylsulfinamoyl, N-n-Propylsulfinamoyl, N-1-Methylethylsulfinamoyl, N-n-Butylsulfinamoyl, N-1-Methylpropylsulfinamoyl, N-2-Methylpropylsulfinamoyl und N-1,1-Dimethylethylsulfinamoyl, insbesondere N-Methylsulfinamoyl;

 $Di-C_1-C_4-Alkylsulfamoyl$ wie Dimethylsulfamoyl, Diethylsulfamoyl, Dipropylsulfamoyl, Dibutylsulfamoyl, N-Methyl-N-ethylsulfamoyl,

- 40 N-Methyl-N-propylsulfamoyl, N-Methyl-N-1-methylethylsulfamoyl, N-Methyl-N-1,1-Dimethylethylsulfamoyl, Di-1-Methylethylsulfamoyl, N-Ethyl-N-1-Methylethylsulfamoyl und N-Ethyl-N-1,1-dimethyl ethylsulfamoyl; insbesondere Dimethylsulfamoyl;
- 45 Di-C₁-C₄-Alkylsulfinamoyl wie Dimethylsulfinamoyl, Diethylsulfinamoyl, Dipropylsulfinamoyl, Dibutylsulfinamoyl, N-Methyl-N-ethylsulfinamoyl, N-Methyl-N-propylsulfinamoyl, N-Methyl-N-l-methyl-

ethylsulfinamoyl, N-Methyl-N-1,1-Dimethylethylsulfinamoyl, Di-1-Methylethylsulfinamoyl, N-Ethyl-N-1-Methylethylsulfinamoyl und N-Ethyl-N-1,1-dimethyl ethylsulfinamoyl; insbesondere Dimethylsulfinamoyl,

5

C;-C4-Alkylsulfinyloxy wie Methylsulfinyloxy, Ethylsulfinyloxy, n-Propylsulfinyloxy, l-Methylethylsulfinyloxy, n-Butylsulfinyloxy, loxy, l-Methylpropylsulfinyloxy, 2-Methylpropylsulfinyloxy und l,l-Dimethylethylsulfinyloxy, insbesondere Methylsulfinyloxy;

10

C₁-C₄-Alkylsulfonyloxy wie Methylsulfonyloxy, Ethylsulfonyloxy, n-Propylsulfonyloxy, 1-Methylethylsulfonyloxy, n-Butylsulfonyloxy, l-Methylpropylsulfonyloxy, 2-Methylpropylsulfonyloxy und 1,1-Dimethylethylsulfonyloxy, insbesondere Methylsulfonyloxy;

15

 $C_1-C_4-Alkylsulfinylamino$ wie Methylsulfinylamino, Ethylsulfinylamino, n-Propylsulfinylamino, 1-Methylethylsulfinylamino, n-Butylsulfinylamino, 1-Methylpropylsulfinylamino, 2-Methylpropylsulfinylamino und 1,1-Dimethylethylsulfinylamino, insbesondere Methylsulfinylamino, ins

20 thylsulfinylamino;

C:-C4-Alkylsulfonylamino wie Methylsulfonylamino, Ethylsulfonylamino, n-Propylsulfonylamino, 1-Methylethylsulfonylamino, n-Butylsulfonylamino, 1-Methylpropylsulfonylamino, 2-Methylpropylsulfonylamino und 1,1-Dimethylethylsulfonylamino, insbesondere Methylsulfonylamino;

N-C:-C4-Alkylsulfinyl-N-methyl-amino wie N-Methylsulfinyl-N-methyl-amino, N-Ethylsulfinyl-N-methyl-amino, N-n-Propylsulfinyl-N30 methyl-amino, N-1-Methylethylsulfinyl-N-methyl-amino, N-n-Butyl-sulfinyl-N-methyl-amino, N-1-Methylpropylsulfinyl-N-methyl-amino, N-2-Methylpropylsulfinyl-N-methyl-amino und N-1,1-Dimethylethyl-sulfinyl-N-methyl-amino, insbesondere N-Methylsulfinyl-N-methyl-amino;

35

N-C:-C4-Alkylsulfinyl-N-ethyl-amino wie N-Methylsulfinyl-N-ethyl-amino, N-Ethylsulfinyl-N-ethyl-amino, N-n-Propylsulfinyl-N-ethyl-amino, N-n-Butylsulfinyl-N-ethyl-amino, N-n-Butylsulfinyl-N-ethyl-amino, N-1-Methylpropylsulfinyl-N-ethyl-amino, N-2-Me-

40 thylpropylsulfinyl-N-ethyl-amino und N-1,1-Dimethylethylsulfinyl-N-ethyl-amino, insbesondere N-Methylsulfinyl-N-ethyl-amino;

N-C:-C4-Alkylsulfonyl-N-methyl-amino wie N-Methylsulfonyl-N-methyl-amino, N-Ethylsulfonyl-N-methyl-amino, N-n-Propylsulfonyl-N-methyl-amino, N-1-Methylethylsulfonyl-N-methyl-amino, N-n-Butyl-sulfonyl-N-methyl-amino, N-1-Methylpropylsulfonyl-N-methyl-amino, N-2-Methylpropylsulfonyl-N-methyl-amino und N-1,1-Dimethylethyl-

sulfonyl-N-methyl-amino, insbesondere N-Methylsulfonyl-N-methyl-amino:

N-C:-C4-Alkylsulfonyl-N-ethyl-amino wie N-Methylsulfonyl-N-ethyl-5 amino, N-Ethylsulfonyl-N-ethyl-amino, N-n-Propylsulfonyl-N-ethyl-amino, N-1-Methylethylsulfonyl-N-ethyl-amino, N-n-Butylsulfonyl-N-ethyl-amino, N-2-Methyl-amino, N-1-Methylpropylsulfonyl-N-ethyl-amino, N-2-Methylpropylsulfonyl-N-ethyl-amino und N-1,1-Dimethylethylsulfonyl-N-ethyl-amino, insbesondere N-Methylsulfonyl-N-ethyl-amino;

10

 C_1 - C_4 -Halogenalkylthio wie Chlormethylthio, Dichlormethylthio, Trichlormethylthio, Fluormethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, Chlordifluormethylthio, 1-Fluorethylthio, 2-Fluorethylthio, 2,2-Difluorethylthio,

15 2,2,2-Trifluorethylthio, 2-Chlor-2,2-difluorethylthio, 2,2-Dichlor-2 fluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio und Penta-fluorethylthio, insbesondere Trifluormethylthio.

Die vorstehend definierte Gruppe $-(Y)_n$ -CO-R⁸ steht beispielsweise **20** für

C.-C4-Alkylcarbonyl wie Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl, n-Propyl-carbonyl, 1-Methylethylcarbonyl, n-Butylcarbonyl, 1-Methylpropyl-carbonyl, 2-Methylpropylcarbonyl und 1,1-Dimethylethylcarbonyl, insbesondere Methylcarbonyl;

C:-C4-Alkoxycarbonyl wie Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, n-Propoxycarbonyl, 1-Methylethoxycarbonyl, n-Butoxycarbonyl, 1-Methylpropoxycarbonyl, 2-Methylpropoxycarbonyl und 1,1-Dimethylethoxy-30 carbonyl, insbesondere Methoxycarbonyl; —

N-C₁-C₄-Alkylcarbamoyl wie N-Methylcarbamoyl, N-Ethylcarbamoyl, N-n-Propylcarbamoyl, N-1-Methylethylcarbamoyl, N-n-Butylcarbamoyl, N-1-Methylpropylcarbamoyl, N-2-Methylpropylcarbamoyl und N-1,1-Dimethylethylcarbamoyl, insbesondere N-Methylcarbamoyl;

Di-C:-C4-Alkylcarbamoyl wie Dimethylcarbamoyl, Diethylcarbamoyl, Dipropylcarbamoyl, Dibutylcarbamoyl, N-Methyl-N-ethylcarbamoyl, N-Methyl-N-propylcarbamoyl, N-Methyl-N-1-methylethylcarbamoyl, N-Methyl-N-1-methylcarbamoyl, N-Me

- 40 Methyl-N-1,1-Dimethylethylcarbamoyl, Di-1-Methylethylcarbamoyl, N-Ethyl-N-1-Methylethylcarbamoyl und N-Ethyl-N-1,1-dimethyl ethylcarbamoyl; insbesondere Dimethylcarbamoyl;
- C:-C4-Alkylcarbonyloxy wie Methylcarbonyloxy, Ethylcarbonyloxy, 45 n-Propylcarbonyloxy, 1-Methylethylcarbonyloxy, n-Butylcarbonyloxy, loxy, 1-Methylpropylcarbonyloxy, 2-Methylpropylcarbonyloxy und 1,1-Dimethylethylcarbonyloxy, insbesondere Methylcarbonyloxy;

C:-C4-Alkylcarbonylamino wie Methylcarbonylamino, Ethylcarbonylamino, n-Propylcarbonylamino, l-Methylethylcarbonylamino, n-Butylcarbonylamino, 1-Methylpropylcarbonylamino, 2-Methylpropylcarbonylamino und 1,1-Dimethylethylcarbonylamino, insbesondere Methyl-5 carbonylamino;

N-C:-C4-Alkylcarbonyl-N-methyl-amino wie N-Methylcarbonyl-N-methyl-amino, N-Ethylcarbonyl-N-methyl-amino, N-n-Propylcarbonyl-Nmethyl-amino, N-1-Methylethylcarbonyl-N-methyl-amino, N-n-Butyl-10 carbonyl-N-methyl-amino, N-1-Methylpropylcarbonyl-N-methyl-amino, N-2-Methylpropylcarbonyl-N-methyl-amino und N-1,1-Dimethylethylcarbonyl-N-methyl-amino, insbesondere N-Methylcarbonyl-N-methylamino.

15 Z steht beispielsweise für:

5- oder 6-gliedriger heterocyclischer, gesättigter oder ungesättigter Rest, enthaltend ein bis drei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, beispielsweise

- 20 fünfring Heteroaromaten wie 2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, 2-Pyrrolyl, 3-Pyrrolyl, 3-Isoxazolyl, 4-Isoxazolyl, 5-Isoxazolyl, 3-Isothiazolyl, 4-Isothiazolyl, 5-Isothiazolyl, 3-Pyrazolyl, 4-Pyrazolyl, 5-Pyrazolyl, 2-Oxazolyl, 4-Oxazolyl, 5-Oxazolyl, 2-Thiazolyl, 4-Thiazolyl, 5-Thiazolyl, 2-Imidazolyl,
- 25 4-Imidazolyl, 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl, 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,2,3-Oxadiazol-4-yl, 1,2,3-Oxadiazol-5-yl, 1,2,5-0xadiazol-3-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl,
 - 1, 2, 4-Thiadiazol-5-yl, 1, 3, 4-Thiadiazol-2-yl,
 - 1,2,3-Thiadiazol-4-yl, 1,2,3-Thiadiazol-5-yl,
- **30** 1,2,5-Thiadiazol-3-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, , 1,3,4-Triazol-2-yl,1,2,3-Triazol-4-yl, 1,2,3-Triazol-5-yl, 1,2,4-Triazol-5-yl, Tetrazol-5-yl, insbesondere 2-Thiazolyl und 3-Isoxazolyl;
- 35 sechsring Heteroaromaten wie 2-Pyridinyl, 3-Pyridinyl, 4-Pyridinyl, 3-Pyridazinyl, 4-Pyridazinyl, 2-Pyrimidinyl, 4-Pyrimidinyl, 5-Pyrimidinyl, 2-Pyrazinyl, 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Triazin-5-yl und 1,2,4-Triazin-3-yl, 1,2,4-Triazin-6-yl, 1, 2, 4, 5-Tetrazin-3-yl;

40 5- bis 6-gliedrige, gesättigte oder teilweise ungesättigte Heterocyclen, enthaltend ein bis drei Stickstoffatome und/oder ein oder zwei Sauerstoff- oder Schwefelatom wie 2-Tetrahydrofuranyl, 3-Tetrahydrofuranyl, 2-Tetrahydrothienyl, 3-Tetrahydro-

45 thienyl, Tetrahydrothiopyran-2-yl, Tetrahydrothiopyran-3-yl, Tetrahydrothiopyran-4-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl, 1,3-Dithiolan-4-yl, 1-3-Dithian-2-yl, 1,3-Dithian-4-yl, 5,6-Dihydro-4H-1,3thiazin-2-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl, 1-Pyrrolidinyl, 2-Pyrrolidinyl, 3-Pyrrolidinyl, 3-Isoxazolidinyl, 4-Isoxazolidinyl, 5-Isoxazolidinyl, 3-Isothiazolidinyl, 4-Iso-thiazolidinyl, 5-Isothiazolidinyl, 3-Pyrazolidinyl,

- 5 4-Pyrazolidinyl, 5-Pyrazolidinyl, 2-Oxazolidinyl, 4-Oxazolidinyl, 5-Oxazolidinyl, 2-Thiazolidinyl, 4-Thiazolidinyl, 5-Thiazolidinyl, 2-Imidazolidinyl, 4-Imidazolidinyl, 1,2,4-Oxadiazolidin-3-yl, 1,2,4-Oxadiazolidin-5-yl, 1,2,4-Thiadia-zolidin-3-yl, 1,2,4-Thiadiazolidin-5-yl, 1,3,4-Oxadia-
- 20 zolidin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolidin-2-yl, 1,3,4-Triazolidin-2-yl,
 2,3-Dihydrofur-2-yl, 2,3-Dihydrofur-3-yl, 2,4-Dihydrofur-2-yl,2,4-Dihydrofur-3-yl, 2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl,
 2,4-Dihydrothien-2-yl, 2,4-Dihydrothien-3-yl,
 2,3-Pyrrolin-2-yl, 2,3-Pyrrolin-3-yl, 2,4-Pyrrolin-2-yl,
- 15 2,4-Pyrrolin-3-yl, 2,3-Isoxazolin-3-yl, 3,4-Isoxazolin-3-yl, 4,5-Isoxazolin-3-yl, 2,3-Isoxazolin-4-yl, 3,4-Isoxazolin-4-yl, 4,5-Isoxazolin-4-yl, 2,3-Isoxazolin-5-yl, 3,4-Isoxazolin-5-yl, 4,5-Isoxazolin-5-yl,2,3-Isothiazolin-3-yl, 3,4-Isothiazolin-3-yl, 4,5-Isothiazolin-3-yl, 2,3-Isothiazolin-4-yl, 3,4-Isothia-
- 20 zolin-4-yl, 4,5-Isothiazolin-4-yl, 2,3-Isothiazolin-5-yl,
 3,4-Isothiazolin-5-yl, 4,5-Isothiazolin-5-yl, 2,3-Dihydropyrazol-1-yl, 2,3-Dihydropyrazol-2-yl, 2,3-Dihydropyrazol-3-yl,
 2,3-Dihydropyrazol-4-yl, 2,3-Dihydropyrazol-5-yl, 3,4-Dihydropyrazol-1-yl, 3,4-Dihydropyrazol-3-yl, 3,4-Dihydropyrazol-4-yl,
- 25 3,4-Dihydropyrazol-5-yl, 4,5-Dihydropyrazol-1-yl, 4,5-Dihydropyrazol-3-yl, 4,5-Dihydropyrazol-4-yl, 4,5-Dihydropyrazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl, 4,5-Dihydrooxazol-5-yl, 1,3-Dioxolan-2-yl,
- 30 1,3-Dioxolan-4-yl, 1,3-Dioxan-5-yl, 1,4-Dioxan-2-yl, 2-Piperidinyl, 3-Piperidinyl, 4-Piperidinyl, 3-Tetrahydropyridazinyl, 4-Tetrahydropyrimidinyl, 4-Tetrahydropyrimidinyl, 5-Tetrahydropyrimidinyl, 2-Tetrahydropyrimidinyl, hydropyrimidinyl, 5-Tetrahydropyrimidinyl, 2-Tetrahydropyrazinyl, 1,3,5-Tetrahydro-triazin-2-yl und 1,2,4-Tetrahydrotriazin-3-yl,
- 35 insbesondere 2-Tetrahydrofuranyl, 1,3-Dioxolan-2-yl und 1,3-Dioxan-2-yl,

der gegebenenfalls durch

40 Halogen wie vorstehend genannt, insbesondere Fluor oder Chlor,

Cyano, Nitro,

eine Gruppe -COR⁸, beispielsweise Alkylcarbonyl wie vorstehend ge-45 nannt, Alkoxycarbonyl wie vorstehend genannt, N-Alkylcarbamoyl wie vorstehend genannt, Dialkylcarbamoyl wie vorstehend genannt; C:-C4-Alkyl wie vorstehend genannt,

C:-C4-Halogenalkyl wie beispielsweise Chlormethyl, Difluormethyl, Dichlormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl, Chlordifluor
5 methyl, 1-Fluorethyl, 2-Fluorethyl, 2,2-Difluorethyl,
1,1,2,2-Tetrafluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethyl und Pentafluorethyl, Decafluorbutyl, 1,1-Bis-trifluormethyl-2,2,2-trifluorethyl, bevorzugt Difluormethyl, Trifluormethyl, Trichlormethyl und Chlordifluormethyl;

10

 C_3 - C_6 -Cycloalkyl, wie beispielsweise Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl, Cyclohexyl, Cyclohexyl, Cyclooctyl, insbesondere Cyclopropyl und Cyclohexyl;

15 C:-C4-Alkoxy wie vorstehend genannt,

 C_1-C_2 -Halogenalkoxy wie beispielsweise Chlormethoxy, Dichlormethoxy, Trichlormethoxy, Fluormethoxy, Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy, Dichlorfluormethoxy, 1-Fluormeth-

- 20 oxy, 2-Fluorethoxy, 2,2-Difluorethoxy, 1,1,2,2-Tetrafluorethoxy, 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-1,1,2-trifluorethoxy und Penta-fluorethoxy, insbesondere C₁-C₃-Halogenalkoxy wie 2,2,2-Trifluorethoxy und 2-Chlor-2,2-difluorethoxy;
- 25 C_1-C_4 -Alkylthio wie vorstehend genannt,

C:-C:-Halogenalkylthio wie vorstehend genannt,

Di-C:-C:-Alkylamino wie beispielsweise Dimethylamino, Diethyl30 amino, Dipropylamino, Dibutylamino, N-Methyl-N-ethylamino, N-Methyl-N-propylamino, N-Methyl-N-l-methylethylamino, N-Methyl-N-1,l-Dimethylethylamino, Di-l-Methylethylamino, NEthyl-N-l-methylethylamino und N-Ethyl-N-l,l-dimethyl ethylamino;

35 gegebenenfalls substituiertes Phenyl

oder eine Oxogruppe, die gegebenenfalls auch in der tautomeren Form als Hydroxygruppe vorliegen kann, substituiert ist, beispielsweise Thiazolin-4,5-dion-2-yl, 3-0xo-3H-1,2,4-dithiazolyl oder 2-0xo-2H-1,3,4-dithiazolyl.

Benzokondensierte 5- oder 6-Ring-Heteroaromaten sind beispielsweise Benzofuranyl, Benzothienyl, Indolyl, Benzoxazolyl, Benzisoxazolyl, Benzthiazolyl, Benzisothiazolyl, Benzpyrazolyl,

45 Indazolyl, 1,2,3-Benzothiadiazolyl, 2,1,3-Benzothiadiazolyl, Benzotriazolyl, Benzofuroxanyl, Chinolinyl, Isochinolinyl, Cinnolinyl, Chinoxalinyl oder Phthalazinyl. Bei-

spiele für besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I sind in den folgenden Tabellen 1 bi 5 zusammengestellt.

Tabelle 1: Verbindungen der Struktur Id

27	در
∑ —⟨	
°=	/— _
₽—	~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~~
	R R 7

Id

		-				
Nr.	R ³	ž	R5	<u>.</u>	Σ	2
1.12	н	н	H	SO ₂ CH ₃	c1	2-Thienyl
1.13	Н	н	H	SO ₂ CH ₃	c1	3-Thienyl
1.14	H	H	н	SO ₂ CH ₃	c1	2-Furyl
1.15	н	н	Н	SO ₂ CH ₃	c1	3-Fury1
1.16	н	н	н	SO ₂ CH ₃	cı	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.17	Н	Н	Н	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazoly1
1.18	Н	Н	Н	SO ₂ CH ₃	cı	4-Thiazolyl
1.19	н	н	н	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazoly1
1.20	Н	н	н	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isothiazol-5-yl
1.21	н	н	н	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
1.22	н	Н	Н	SO ₂ CH ₃	C1	5-Phenyl-thiazol-2-yl
1.23	Н	Н	Н	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
1.24	н	Н	Н	502СН3	Cl	3-Pyridy1

												24					_	_	_				_
2	4-Pyridyl	1-Methyl-2-pyrrolyl	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl	2-Benzthiazolyl	0 Chinoline	Z-Chinolinyi	1-Methylbenzımıdazol-z-yı	2-0xazoly1	1-Phenyl-pyrazol-5-yl	1-Methyl-pyrazol-3-yl	1-Methy1-pyrazol-5-y1	1,3-Dimethylpyrazol-3-yl	1-Phenyl-pyrazol-3-yl	1,4-Dimethylpyrazol-5-yl	1,3-Dimethylpyrazol-4-yl	1.5-Dimethylpyrazol-4-yl	1-Nothv1-nvrazo1-4-v1	I-memyi pyrasor i ji	1,3-Dimethylpyrazol-5-Yı	4-Methyl-oxazol-2-yl	5-Methylthio-thiazol-2-yl	4-Methoxy-1-methylpyrazol-5-yl	3-Cyclopropylisoxazol-5-yl
M	C1	C1	C1	[]	5	C1	C1	Cl	C1	c1	C1	c1	C1	C1	15	5 5	5	CI	C1	C1	C1	C1	C1
L	SO ₂ CH ₃		SOCH	20,200	SO ₂ CH ₃	SO-CH.	SO-CH.	50000	302cm3	SO ₂ CH3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	S02CH3	SO ₂ CH ₃	SO,CH3							
R5	=	=		T	<u> </u>	H	H	E	Ξ	Ξ	E	I	: :		c :	<u> </u>	Ξ	王	H	트	=	=	=
R4	I	=	T		H	н	Ŧ	Ξ	Ξ	×	=	=	: :	:	=	=	Ξ	H	三	=	=	: =	=
R3	Œ	7	: :	=	H	H	E	H	Ξ	Ξ	=	_=	<u> </u>	=	=		н	H	E	=	: =	= =	
Nr.	1.25	1 26	1.60	1.2/	1.28	1.29	1.30	1.31	1.32	1.33	1 34	1 25	1.33	1.36	1.37	1.38	1.39	1.40	1.41	1 42	1.32	7.4.5	1.44

	Г				_								25										
	2	3-Isopropylisoxazol-5-vl	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-v1	5-Wethyl-thiazol-2-v1	4-Brom-2-thienvl	5-Methyl-2-thienyl	4-Methyl-2-thienvl	4-Methyl-thiazol-2-vl	4-Chlor-thiazol-2-v1	4,5-Dimethylthiazol-2-vl	4-Phenyl-thiazol-2-vl	2-Methoxv-thiazol-5-v1	4-Wothv1-2	- recult 2-2-pyridyi	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl	6-Methylthio-2-pyridyl	6-Methoxy-3-pyridyl	6-Methoxy-2-pyridv1	6-Methyl-2-pyridyl	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridy;	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridy;	5-Pyrimidinyl	6-Dimethylamino-3-pyridyl
	Σ.	C1	C.1	1 2	C1	C1	C1	C1	C1	Cl	C1	c1	c1										
	П	SO ₂ CH ₃	SO ₂ СН ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	-nJ-08	302cm3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃										
1,55	ž	Н	н	프	E	H	Ξ	E	Ξ	H	Н	Ξ	Ξ]=		Ξ	H	н	H	Ξ	E	H	Ŧ
100		Ξ	Н	н	E	Ŧ	H	H	Н	Н	н	Н	H	=	:	Œ	H	Н	Н	E	H	Ξ	H
63		Ξ	H	Н	=	H	н	Н	Н	Н	Н	Н	H]=	:	=	Ξ	н	Н	н	н	Ξ	Н
, in		1.46	1.47	1.48	1.49	1.50	1.51	1.52	1.53	1.54	1.55	1.56	1.57	1.58		1.59	1.60	1.61	1.62	1.63	1.64	1.65	1.66

BNSDOCID- >WO GESESONAL L >

													26									_			_	_	
2	1 2 4-Thiadiazol-5-vl	2-Ethowycarbonvl-1-methvl-pyrazol-5-yl	3-ELIIOA) caracis.	2-Methylthio-pyrımıdın-5-yı	2-Pyrimidinyl	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl	5-Mothvithio-1, 3, 4-thiadiazol-2-yl	E-Mothows-1 3 4-thiadiazol-2-yl	J. F. D. L. J. Z. Z. L. P. L. J. J. L. J. J. L. J.	4,5-Dinyaro-chicaco	5-Metny1-0xazo1-2-y1	5-Phenyl-oxazol-2-y1	2-Methyl-oxazol-5-yl	2-Phenv1-oxazo1-5-y1	0 4.1.1.1 2 A.ovadiazol-5-Vl	Z-Metny1-1,5,4-0Addiagor 5 3-	2-Pheny1-1, 3, 4-0xad1a201-5-y1	5-Trifluormethy1-1,2,4-oxadiazo1-3-yl	5-Methv1-1.2.4-oxadiazol-3-y1	7 - 1 - 1 - 1 - 1 - 1 - 1 - 1 - 1 - 1 -	5-Phenyl-1,2,4-Oxaulazot 3 1.	5-Phenyl-isoxazol-3-yl	1-(4-Chlorphenyl)-1,2,4-triazol-2-yl	r 2 1 C-2; hudro-; coxazol-3-v]	5-Cyano-4, 5-dinyuto isonasos o 1-	5,6-Dihydro-4H-1,3-tn1d21H-2-y1	
	E	CI	C.I	C1	C1	[.]	5 6	17	C1	C1	C1	<u>C</u>]	C1	6	5	C1	C1	[]	5 8	13	C1	C1	5	17	Cl	C1	
	L	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	5	SU2CR3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	CO. Cu.	SU2CE 3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	50700	SU ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO.CH.	202	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	
ſ	R2	Ξ	E	-	T		Ę	Ξ	H	н	H	æ		E	Ħ	H].		=	Œ	프	1.		Œ.	王	=	
Ī	R4	<u> </u>	H	=		1	F	Н	н	н	H	=	$\left\{ \right\}$	Ξ	Ħ	H	6	<u></u>	H	Ħ	\ E	<u> </u>	=	Œ	三	E	
	R3	Н	н	=	1	=	н	н	н	Ξ	H	2		Н	н	H		=	æ	Н	=	<u> </u>	Ξ	Н	=	=	:
	Nr.	1.67	1.68	1 60	1.03	1.70	1.71	1.72	1.73	1.74	1.75	36 +	۲. ۱۵	1.77	1.78	1 20		1.80	1.81	1.82	2 83		1.84	1.85	1 86	1 87	· · ·

			_			_	_		_		2	7	_								., .
Z	1,3-Dithiolan-2-yl	1,3-Dioxolan-2y1	1,3-Dithian-2-y1	1,3-Dioxan-2-y1	1,3-Oxathiolan-2-yl	1,2,4-Triazol-1yl	3-Methyl-1, 2, 4-thiadiazol-5-yl	1,2,4-Thiadiazo1-5-y1	Thiazolin-4,5-dion-2-yl	3-0xo-3-H-1,2,4-dithiazol-5-yl	2-0xo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl	1-Pyrroly1	1-Pyrroly1	1-Pyrroly1	3,5-Dimethyl-pyrazol-1-yl	2-Thienyl	3-Thienyl	2-Furyl	3-Fury1	3-Methyl-isoxazol-5-yl	5-Thiazoly1
Σ	C1	C1	c1	C1	C1	CI	13	Cl	13	Cl	C1	Н	13	н	Н	13	ເວ	c1	13	13	C1
ī	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	NO2	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	NO2	NO ₂	NO ₂	NO2	ZON S	ZON S	NO ₂						
RS	н	н	Н	н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	н	н	Н
R4	н	Н	Н	Н	Н	Н	н	н	Н	Н	Н	н	Н	Н	н	н	Н	H	н	H	Н
R3	н	Н	н	Н	Н	Н	н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	H	ェ	Ħ	н
Nr.	1.88	1.89	1.90	16.1	1.92	1.93	1.94	1.95	1.96	1.97	1.98	1.99	1.100	1.101	1.102	1.103	1.104	1.105	1.106	1.107	1.108

BNSDOCID: <WO 9626200A1 1 >

													28	3	- 1			_	_			Τ-	_		_	Т	7	
2	4-Thiazolyl	2-mhi 2201V]	111000111-7	3-Methyl-isothiazol-5-yl	3-Isoxazolyl	E-phonyl-thiazol-2-vl	O-Friend's Comments	2-Py1 1dy 1	3-Pyridyl	4-Pyridyl	1-Methyl-2-pyrrolyl	1-Mothyl-1 2.4-triazol-5-yl	I ment at at	2-Benztniazoty1	2-Chinolinyl	1-Methyl-benzimidazol-2-yl	1 (CC::) - CC::) - CC::	Z-Uxazo1y1	1-Phenyl-pyrazol-5-yl	1-Methyl-pyrazol-3-yl	1 11-12-10-12-10-12-12-12-12-12-12-12-12-12-12-12-12-12-	I-Metnyi-pyrazor 3 rt	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl	1-phony1-pyrazo1-3-y1		1,4-Dimetny1-pytazot-3-y1	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl	
>	: 5		C1	C1	- 5	ן נו	CI	C1	C1	C1	5	7.	CI	ច	5	5 6	5	<u>C1</u>	<u>C1</u>	5	13	C1	C.1		15	C1	[3]	
		NO ₂	NO2	ģ	NO2	NO ₂	NO ₂	NO ₂	NO ₂		NO2	NO ₂	NO ₂	NO		NO ₂	NO ₂	NO,	J. O.	NO2	NO ₂	NO2	300	NO ₂	NO ₂	NO2	92	NO ₂
	1			T	1					1	-	Ξ	Æ	12	1		Ħ	=	T	E	Ŧ	=		Н	Ħ] =		I
	<u>~</u>	Ŧ	Н	1	1	Ξ_	=	H		1		H			1	Ξ	H	,	1	<u>.</u>	H	=		H	E	2	:	н
}	R ³ R	王	H	1	Ξ.	H	Н		1	1	E	H	=	T	=	H	H	T		H	н	,		X	Ħ	:	=	H
	Nr. R	1.109 H	110 H	1	1.111 H	1.112 H	1.113	1	\dagger	7	1.116	1.117	T	1	1.119	1.120	1.121		1.122	1.123	1.124	, ,	1.125	1.126	1 127		1.128	1.129

RNSDOCID: <WO 9626200A1 1 >

R3	3 R4		R5	L	×	2
=	H	Н		NO ₂	Cl	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl
H	н	H		NO2	Cl	1-Methyl-pyrazol-4-yl
Ή	æ	H		NO ₂	C1	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl
.133 Н	н	Н		NO ₂	Cl	4-Methyl-oxazol-2-yl
.134 Н	н	Н		NO ₂	C1	5-Methy1thio-thiazol-2-yl
.135 н	н	Н		NO ₂	C1	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl
.136 н	н	Н		NO ₂	C1	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl
.137 Н	Н	Н		NO ₂	C1	3-Isopropyl-isoxazol-5-yl
.138 н	Н	Н		NO ₂	C1	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl
.139 н	H	Н		NO ₂	C1	5-Methyl-thiazol-2-yl
.140 Н	н	Н		NO ₂	C1	4-Brom-2-thienyl
.141 Н	H	H		NO ₂	C1	5-Methyl-2-thienyl
H	Н	Н		NO ₂	c1	4-Methyl-2-thienyl
H	Н	Н		NO ₂	C1	4-Methyl-thiazol-2-yl
.144 H	Н	Н		NO ₂	C1	4-Chlor-thiazol-2-yl
5 н	Н	Н		NO ₂	C1	4,5-Dimethyl-thiazol-2-yl
Н 9	Н	н		NO ₂	C1	4-Phenyl-thiazol-2-yl
.147 H	н	н		NO ₂	C1	2-Methoxy-thiazol-5-yl
.148 H	Н	Н		NO ₂	C1	4-Methyl-2-pyridyl
	Н	Н		NO ₂	C1	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl
H	н	H		NO ₂	C1	6-Methylthio-2-pyridyl

	_					,	_	_			Т	Т	_	3 O	_		Т	Т	Т	7		T	Т	Т			1
4	2	6-Methoxy-3-pyridyi	6-Methoxy-2-pyridyl	6-Methyl-2-pyridyl	6-(2.2.2-Trifluorethoxy)-2-pyridyl	c c c c c maifficanthown - 3-nvridy	6-(2,2,2-Tritluoretnoxy)-3-pyridyi	5-Pyrimidinyl	6-Dimethylamino-3-pyridyl	1 2 4-mbjadjazol-5-vl	1,2,7.	3-Ecnoxycationiyi i mediga kyraca-	2-Methylthio-pyrimidin-5-yı	2-Pyrimidinyl	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl	E-Mothylthio-1.3.4-thiadiazol-2-yl	3-Mechy Lent C 1 4 Little 1 2 - c 1	5-Methoxy-1,3,4-tnladlazol-2-yl	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl	5-Methyl-oxazol-2-yl	5-phenyl-oxazol-2-yl	2	2-Metny1-uxazor-3-yı	2-Phenyl-oxazol-5-yl	2-Methyl-1,3,4-oxadiazol-5-yl	2-pheny1-1,3,4-oxadiazol-5-yl	
	Σ	Cl	C1	C1	15	15	c1	C1	[2]		I.	C1	Cl	c1	10	3	C1	C]	C1	C1	5	1	C1	C1	C1	[3
	L	NO ₂	NO	202	NO2	NO ₂	NO ₂	NO.	70	NO ₂	NO ₂	NO ₂	NO2	NO.	701	NO ₂	NO ₂	NO ₂	NO ₂	NO.	Zou	NO ₂	NO ₂	NO ₂	- ON	7011	NO ₂
t	R ⁵	=	-			H	Ξ	T		E	H	н	E]:	c :	Ξ	I	Ħ	=	: :		Œ	H	=	<u> </u>		三
t	R4	H					=	1	1	=	Œ.	H	=		=	H	H]=	= =	: :	<u>=</u>	Œ	王	=		=	H
	R3			1	=	H	-	T		Ξ	H	Ξ	=		E	æ	Н	2	: :		E	×	E	1=		E	Ξ
	Nr.	1.151	T	761.	1.153	1.154	1 155		1.156	1.157	1.158	1.159	1 160	1.100	1.161	1.162	1.163	1 164	1.10	1.165	1.166	1.167	1.168		1.103	1.170	1.171

_	_	_	-, -				_	_	1	—	3	1		 -							
2	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-vl	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-vl	5-Phenyl-1, 2, 4-oxadiazol-3-vl	5-Phenyl-isoxazol-3-yl	1-(4-Chlorphenyl)-1,2,4-triazol-2-vl	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl	1,3-Dithiolan-2-yl	1,3-Dioxolan-2yl	1,3-Dithian-2-yl	1,3-Dioxan-2-y1	1,3-Oxathiolan-2-yl	1,2,4-Triazol-lyl	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	Thiazolin-4,5-dion-2-yl	3-0xo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-yl	2-0xo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl	2-Thienyl	3-Thienyl	2-Furyl
M	C1	cı	C1	C1	C1	c1	c1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1
1	NO ₂	NO ₂	NO ₂	NO ₂	NO ₂	NO ₂	NO ₂	NO ₂	NO ₂	NO ₂	NO ₂	ZON	NO ₂	NO ₂	ZON S	NO ₂	NO2	NO ₂	C1	[]	C1
RS	н	H	Ħ	Ξ.	H	н	Н	Н	Н	Н	Н	н	н	Н	Н	Н	Н	H	Н	н	н
R4	Н	Н	Ξ	Œ	н	Н	Н	н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	н	Н	н	Н
R ³	Н	Н	H	H	Н	Н	н	н	Н	Н	н	Н	H	H	Н	н	н	H	н	Н	Н
Nr.	1.172	1.173	1.174	1.175	1.176	1.177	1.178	1.179	1.180	1.181	1.182	1.183	1.184	1.185	1.186	1.187	1.188	1.189	1.190	1.191	1.192

	13	R4	R5	1.1	Σ	2
\top	1	1	十	C1	C1	3-Furyl
1		1	1		C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.194		-	1		[]	5-Thiazolyl
1.195	H	H	<u> </u>	C1	5 3	4-mhiazolv1
1.196	H	H	Н	C1	C1	2-miazolv]
1.197	I	E	Н	C1	CI	2 mitters
1.198	Ξ	H	H	Cl	CI	3-160×220]V]
1.199	I	H	н	Cl	CI	
1.200	æ	H	Н	C1	C1	o presided
1 201	Ξ	E	Ħ	C1	C1	1 thi 14-7
1 202	Ξ	H	Ŧ	C1	C1	3-Pyriayı
2021]:] =	=	c1	C1	4-Pyridy1
1.203				5	<u>c1</u>	1-Methyl-2-pyrrolyl
1.204	Н	H	E	5	5	1-Methy1-1,2,4-triazol-5-yl
1.205	Н	X	E.	C1		2-Benzthiazolvl
1 206	E	三	н	C1	CI	
1 207]=	Œ	三	C1	C1	2-Chinding 1
1.20]=	2	C1	1-Methyl-benzimidazoi-2-yi
1.208					C1	2-0xazolyl
1.209	H	표	٥	3		1-phenyl-pyrazol-5-yl
1.210	Ξ	Н	王	c 1	3	1 100 thus - 000 thus
1 211	=	=	E	<u>c</u> 1	Cl	1-Metnyi-pyracor 3 f-
1 .		1=	=	13	C1	1-Methyl-pyrazo1-3-y1
1.616	= :		=	[5]	CI	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-y1
1.213	티	듸				

_	_									_	3	3										
2	1-Phenyl-pyrazol-3-yl	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl	1-Methyl-pyrazol-4-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl	4-Methyl-oxazol-2-yl	5-Methylthio-thiazol-2-yl	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl	3-Isopropyl-isoxazol-5-yl	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl	5-Methyl-thiazol-2-yl	4-Brom-2-thienyl	5-Methyl-2-thienyl	4-Methyl-2-thienyl	4-Methyl-thiazol-2-yl	4-Chlor-thiazol-2-yl	4,5-Dimethy1-thiazol-2-yl	4-Phenyl-thiazol-2-yl	2-Methoxy-thiazol-5-yl	
Σ	CJ	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	Cl	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	
Ţ	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	13	CI	cı	13	C1	Cl	Cl	C1	ເວ	ເລ	13	C1	13	C1	
R5	Æ	H	Ħ	Ħ	Ħ	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	
R4	н	Н	н	н	H	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	н	Н	Н	Н	H	н	Н	н	
R3	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	н	н	Н	Н	Н	н	Н	н	Н	Н	Ξ	H	н	н	
Nr.	1.214	1.215	1.216	1.217	1.218	1.219	1.220	1.221	1.222	1.223	1.224	1.225	1.226	1.227	1.228	1.229	1.230	1.231	1.232	1.233	1.234	

	1	T	_			T	7	-	-1			T	3 T	1		Г	Т	Т		_	Т	Т		Τ	T	7]
	2 4 40 thul - 2 - nuridul	4-Mec.ily1-2 Private - 2-mindul	6-(2-Methoxyethy1)-2-py11dy1	6-Methylthio-2-pyridyl	6-Wothow-1-puridul		6-Metnoxy-2-pyridyi	6-Methyl-2-pyridyl	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl	6-(2 2 2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl	יייייייייייייייייייייייייייייייייייייי	5-Pyrimitating	6-Dimethylamino-3-pyridyi	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	3-Fthoxvcarbonvl-1-methyl-pyrazol-5-yl		2-Methylthio-pyrimiani-3-yi	2-Pyrimidinyl	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl	reconstruction and thindiazol-2-vl	5-Metny tunto- 1, 2, 3, 3, 33	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazoi-2-yi	A 5-Dibydro-thiazol-2-vl	The state of the s	5-Methyl-oxazol-2-y1	5-Pheny1-oxazol-2-yl	2-Methv1-oxazo1-5-v1	Thomas a second of the second
	Σ	C1	C1	1.0		CI	C1	C1			C.I.	C1	C1	1.0		CI	C1	C1		13	C1	<u>C1</u>		C1	C1		5 8	101
	I.	C1	[]		17	C1	C1	C1	33		c1	c1	C1		CI	C1	c1	5		c1	10	5	1.7	C1	[]		1.7	C1
	R ⁵ 1	H]]	1	H	×	I	-	T	=	×	H	=	:	Ŧ	н	æ		E	Ξ	H		Ξ	H]=		E	王
	R4	H	=	1	Ŧ	H	=]=		Ŧ	×	Ξ]_=	:	н	Н] =		Н	H	Ξ		I	H	<u> </u>	<u> </u>	Ξ	Ξ
	R ³	I	=		×	H	=		E	H	н	Ξ	7	<u> </u>	エ	H].	اء	I	E	<u>ا</u>		ェ	=		<u>≡</u>	Ξ_	Ξ
	Nr.	1.235	250	1.236	1.237	1.238	1 239	• 1	1.240	1.241	1.242	1 243		1.244	1.245	1.246		1.24	1.248	1.249	250		1.251	1 252	• 1	1.253	1.254	1.255

ſ	T	T	T	T	T	T	T	T	T	T	7	35	\neg	Т	T	T	T	T	T	\neg	\neg
2	2-Pheny1-oxazo1-5-v1	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazol-5-v1	2-Pheny1-1, 3, 4-oxa-diazol-5-vl	5-Trifluormethyl-1,2,4-Oxadiazol-3-v)	5-Methyl-1, 2, 4-oxadiazol-3-vl	5-Pheny1-1, 2, 4-oxadiazo1-3-v1	5-Phenyl-isoxazol-3-yl	1-(4-Chlorphenyl)-1,2,4-triazol-2-v1	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-v1	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-v1	1,3-Dithiolan-2-yl	1,3-Dioxolan-2v1	1,3-Dithian-2-y1	1,3-Dioxan-2-yl	1,3-Oxathiolan-2-yl	1,2,4-Triazol-1yl	3-Methyl-1, 2, 4-thiadiazol-5-vl	1,2,4-Thiadiazol-5-vl	Thiazolin-4,5-dion-2-v1	3-0xo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-vl	2-0x0-2-H-1 3 4-4ithing 6
Σ	c1	C1	C1	Cl	C1	Cl	CJ	Cl	C1	C1	C1	C1	Cl	C1	C1	c1	C1	C1	C1	C1	C1
L	C1	C1	c1	C1	C1	Cl	Cl	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1
RS	H	Ξ	Ξ	ェ	ェ	H	н	Н	Н	Н	H	H	H	H	н	Н	Н	н	Н	Н	H
R4	표	Ξ	E	Œ	Ξ	Н	н	н	Н	Н	н	Н	н	H	н	н	Н	H	H	Н	Ŧ
R3	н	三	Ξ	H	Н	Н	H	Æ	н	н	н	н	H	н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Ξ
Nr.	1.256	1.257	1.258	1.259	1.260	1.261	1.262	1.263	1.264	1.265	1.266	1.267	1.268	1.269	1.270	1.271	1.272	1.273	1.274	1.275	1.276

BNSDOCID: <WO___9626200A1_I_>

	63	4	R5 11	L	Σ	2
	\top		\top	SO ₂ CH ₃	CH3	2-Thienyl
1.2.1		1		SO,CH,	CH ₃	3-Thienyl
1.278	=	1	1		יחי	2-Furvl
1.279	F	H	Ξ	SO ₂ CH ₃	Cn3	2-Birry]
1.280	H	Н	<u> </u>	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Fury.
1.281	Ξ	H	н	SO ₂ CH ₃	СН3	3-Metny1-1s0xazo1-3-71
1.282	=	I	E	SO ₂ CH ₃	СН3	5-Th1a201y1
1 283]=	E	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4-Thiazoly1
707 -	: =	=		SO ₂ CH ₃	СН3	2-Thiazolyl
1.264	= =	: =		SO ₂ CH ₃	СН3	3-Methyl-isothiazol-5-yl
1.202		7		SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Isoxazoly1
1.280		: :	:]=	SO2CH3	CH ₃	5-Phenyl-thiazol-2-yl
1.287	E			(m.700	CH.	2-Pyridyl
1.288	H	н	H	SO ₂ CH ₃	Citis	2-Diridy]
1.289	H	Н	н	SO ₂ CH ₃	СН3	3-rytacy
1 200	==	=	三	SO ₂ CH ₃	СН3	4-Pyridyı
201		=	Ξ	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-2-pyrroly1
1 202	=	=	E	SO ₂ CH ₃	СН3	1-Methyl-1,2,4-trlazol-5-y1
1.632		1=	Ξ	SO ₂ CH ₃	СН3	2-Benzthiazolyl
1.293	=			SOCH	CH ₃	2-Chinolinyl
1.294	=	=		20 CH-	CH3	1-Methy1-benzimidazol-2-y1
1:295	H	Ξ		302cn3		2-0xazolvl
1.296	X	Œ	Ξ	SO ₂ CH ₃	Cn3	1-phony1-pyrazo1-5-v1
1.297	Ξ	王	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-filelit present
	4	1	1			

		_		$\overline{}$	_	_	_	_	-	1	3	/	т-	_		_			1	_	
2	1-Methyl-pyrazol-3-yl	1-Methyl-pyrazol-5-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl	1-Phenyl-pyrazol-3-yl	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl	1-Methyl-pyrazol-4-yl	1,3-Dimethy1-pyrazol-5-yl	4-Methyl-oxazol-2-yl	5-Methylthio-thiazol-2-yl	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl	3-Isopropyl-isoxazol-5-yl	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl	5-Methyl-thiazol-2-yl	4-Brom-2-thienyl	5-Methyl-2-thienyl	4-Methyl-2-thienyl	4-Methyl-thiazol-2-yl	4-Chlor-thiazol-2-yl
Σ	CH ₃	CH ₃	СН3	СН3	СН3	СН3	снз	снз	снэ	снз	снз	СН3									
T	SO ₂ CH ₃	SO ₂ СН ₃	SO ₂ CH ₃																		
RS	н	Н	н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	н	н	н
R4	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	н	н
R ³	Н	н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	н	н	н	Н	н	Н
Nr.	1.298	1.299	1.300	1.301	1.302	1.303	1.304	1.305	1.306	1.307	1.308	1.309	1.310	1.311	1.312	1.313	1.314	1.315	1.316	1.317	1.318

	Ì	Ī	t			6
Nr.	R ³	₽¥	R5	Į.	Σ	
.319	E	E	E	SO ₂ CH ₃	СН3	4,5-Dimethyl-thiazol-2-yl
T	=	=	=	SO ₂ CH ₃	СН3	4-Phenyl-thiazol-2-yl
1 221	=			SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Methoxy-thiazol-5-yl
1361	: :			SOCH	CH ₃	4-Methyl-2-pyridyl
1.322	: :			SO ₂ CH ₃	CH3	6-(2-Methoxyethy1)-2-pyridyl
1.323	=		1	S. 200	CH	6-Methylthio-2-pyridyl
1.324	E	E	E	302cn3		6-Wethoxv-3-nvridvl
1.325	Ξ	H	×	SO ₂ CH ₃	CR3	o rections o present
1.326	H	н	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Metnoxy-2-pyriuyi
1.327	Ξ	н	Н	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-Methyl-2-pyridyi
1.328	H	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridy1
1 329	Ξ	Œ	三	SO ₂ CH ₃	CH ₃	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyrldyl
72.	٤] :	_=	SO,CH,	CH ₃	5-Pyrimidinyl
1.330	=		: :	SO-CH;	CHJ	6-Dimethylamino-3-pyridyl
1.331	=	=		5.0700	CE.	1.2,4-Thiadiazol-5-yl
1.332	æ	H	=	SO ₂ CH ₃	Çiii3	2-prhovugarhonv1-1-methv1-pvrazo1-5-v1
1.333	н	H	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	S-belloxfest Source = more set set set set set set set set set se
1.334	=	Ξ	E	SO ₂ CH ₃	CH ₃	Z-Metnyltnio-pyrimidin-3-yi
1 335	1=	=	三	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Pyrimidinyl
1.333	<u> </u>	2	=	SO,CH,	CH ₃	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl
1.330	= :	<u> </u>		SO-CH2	CH3	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.337	=	=		20 011	, n	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl
1.338	Ξ	Ξ	Н	SU ₂ CH ₃	Citis	4 E.Dibad-thippol-2-vl
1.339	三	Ξ	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	4,3-Dinyaro-chiasor 2 71

_	T	_			_					—		9		_							
2	5-Methyl-oxazol-2-yl	5-Pheny1-oxazo1-2-y1	2-Methyl-oxazol-5-yl	2-Phenyl-oxazol-5-yl	2-Methy1-1,3,4-oxa-diazol-5-yl	2-Pheny1-1, 3, 4-oxa-diazol-5-yl	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	5-Methy1-1,2,4-oxadiazo1-3-y1	5-Pheny1-1,2,4-oxadiazol-3-yl	5-Pheny1-isoxazol-3-yl	1-(4-Chlorphenyl)-1,2,4-triazol-2-yl	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl	1,3-Dithiolan-2-yl	1,3-Dioxolan-2yl	1,3-Dithian-2-yl	1,3-Dioxan-2-yl	1,3-Oxathiolan-2-yl	1,2,4-Triazol-1yl	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
Σ	СН3	CH ₃	CH ₃	СН3	CH ₃	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	снэ	СН3								
1	SO ₂ CH ₃	SO ₂ СН ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃			
RS	H	H	H	Æ	H	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	н	н	Н	Н	н	Н	Н	H
R4	Н	н	H	Ξ	н	Н	Н	н	Н	Н	н	Н	Н	Н	н	Н	Н	н	н	H	Н
R ³	Н	н	Н	н	Н	Н	н	Н	Н	н	Н	н	Н	н	Н	н	Н	н	н	н	H
Nr.	1.340	1.341	1.342	1.343	1.344	1.345	1.346	1.347	1.348	1.349	1.350	1.351	1.352	1.353	1.354	1.355	1.356	1.357	1.358	1.359	1.360

BNSDOCID: <WO___9626200A1_I_>

	Ì	ſ	Γ		2	2
Nr.		R4	R5 1		Li	mr:2201:n-4 5-dion-2-v1
1.361	Ξ	H	<u> </u>	SO ₂ CH ₃	CH ₃	11114201111
1 362	=	Ξ	H	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-0x0-3-H-1,2,3 dr circator 2-2
†	T],	1,	SOCH	CH ₃	2-0xo-2-H-1, 3, 4-d1th1azo1-5-y1
1.363		1	1	5::2707	NO	2-Thienyl
1.364	H	=	н	SO ₂ CH ₃	CIN	2 mt. (2011)
1	E	H	н	SO ₂ CH ₃	CN	3-Inteny.
1	E	Ξ	H	SO ₂ CH ₃	CN	Z-Furyı
T	=	E	Ξ	SO ₂ CH ₃	CN	3-Fury1
T	3	H	Ξ	SO ₂ CH ₃	CN	3-Methyl-isoxazoi-5-yi
十	: =	Ξ	E	SO ₂ CH ₃	CN	5-Thiazolyl
	= :	: :	: 2	SO ₂ CH3	UN	4-Thiazolyl
1.370	Ŧ	=		20,000	NJ	2-Thiazolyl
1.371	I	н	Ξ	SO ₂ CH3		3-Methyl-isothiazol-5-yl
1.372	E	H	Œ	SO ₂ CH ₃	CN	1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1
1 273		=	H	SO ₂ CH ₃	CN	3-1SOXaZO1Y1
25.7				en.CH.	CN	5-Phenyl-thiazol-2-yl
1.374	Ξ		=	3020113	20	2-Pyridyl
1.375	Ξ	Œ	Ξ	SO2CH3	15	2_buridul
1.376	三	×	Ή	SO ₂ CH ₃	CN	J-F#110#1
1 277]=	=	三	SO ₂ CH ₃	CN	4-Pyriayı
1.37	<u> </u>		=	SO,CH,	CN	1-Methyl-2-pyrroly1
1.3/8			<u> </u>	so.CH.	CN	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl
1.379	Ξ	=	=	5500	NU	2-Benzthiazolyl
1.380	王	ェ	H	SO ₂ CH ₃		ן אטן וטטן נאטן נאטן נאטן נאטן נאטן נאטן נאטן נ
1 381	=	=	Ξ	SO2CH 1	CN	2-0111011117
		1				

	_				-,		-,		_	,	4	1		_	.						
Z	1-Methyl-benzimidazol-2-yl	2-0xazolyl	1-Phenyl-pyrazol-5-yl	1-Methyl-pyrazol-3-yl	1-Methyl-pyrazol-5-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl	1-Phenyl-pyrazol-3-yl	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl	1-Methyl-pyrazol-4-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl	4-Methyl-oxazol-2-yl	5-Methylthio-thiazol-2-yl	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl	3-Cyclopropy1-isoxazo1-5-y1	3-Isopropyl-isoxazol-5-yl	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl	5-Methyl-thiazol-2-yl	4-Brom-2-thienyl	5-Methyl-2-thienyl
Σ	CN	CN ·	CN																		
1	SO ₂ CH ₃	so ₂ сн ₃																			
R5	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	н	н	Н	Ŧ
R4	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	н	н	Н	Н	Н	Н	Н
R3	H	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	н	н	н	Н	H	н	Н	н	н	Н
Nr.	1.382	1.383	1.384	1.385	1.386	1.387	1.388	1.389	1.390	1.391	1.392	1.393	1.394	1.395	1.396	1.397	1.398	1.399	1.400	1.401	1.402

NEDOCID- 4MO - 069690041 1

												42											-		
2	4-Methyl-2-thienyl	4-Methyl-thiazol-2-yl	4-Chlor-thiazol-2-yl	4 5-Dimethyl-thiazol-2-yl	1. J.	4-Phenyl-thiazor-z-yı	2-Methoxy-thiazo1-5-Y1	4-Methyl-2-pyridyl	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl	6-Methylthio-2-pyridyl	6-Methoxy-3-pyridyl	6-Methoxy-2-pyridyl	6-Methyl-2-pyridyl	6-(2 2 2-πrifluor-ethoxy)-2-pyridy1	() o muitinor-othowy - 3-nyridy]	6-(2,2,2-IIIIIIII-eulloy)	5-Pyrimidinyl	6-Dimethylamino-3-pyridyl	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	3-Rthoxycarhonvl-1-methyl-pyrazol-5-yl		2-Methylthio-pyrimidin-5-yi	2-Pyrimidinyl	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl	
Σ	CN	CN	N.C.	100	C.S	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	N.C.	15 6	CIN	CN	CN	CN	CN		CS	CN	CN	CN	
L	SO,CH,	SO ₂ CH ₂	20.000	SU2CH3	SO ₂ CH ₃	SO_2CH_3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	SO,CH,	SO, CH,	2070113	SU ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO-CH.	SUZURS	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH1	SOCH	5700
R5	π.	: =		=	H	Н	E	I	E	=	: =		. .	E	H	H	Ξ	=	<u>.</u>	=	프	王]=	علا	:
84	\top		1	=	æ	H	E	=					ı.	Ξ	æ.	H	I	: =		Ξ	Œ	Ξ			E
R3		T	1	<u> </u>	=	E	E	-		1	1		<u> </u>	H	H	E	=	:] :		H	Н	Ħ	: :	<u> </u>	E_
N.T.	. 604	十	\neg	1.405	1.406	1.407	十	1	十	1	\top	1	1.413	1.414	1.415	1.416	1 417	11411	1.418	1.419	1.420	1 421	1 2 2 2	1.922	1.423

	_					_		,	_	,	43	, 									
2	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl	5-Methyl-oxazol-2-yl	5-Pheny1-oxazo1-2-y1	2-Methyl-oxazol-5-yl	2-Phenyl-oxazol-5-yl	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl	2-Phenyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	5-Phenyl-isoxazol-3-yl	1-(4-Chlorpheny1)-1,2,4-triazol-2-y1	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl	1,3-Dithiolan-2-yl	1,3-Dioxolan-2yl	1,3-Dithian-2-yl	1,3-Dioxan-2-γ1	1,3-Oxathiolan-2-yl
Σ	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN	CN
1	so ₂ сн ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
R5	Н	Н	н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	н	Н	Н	н	н	н	н
R4	Н	Н	н	Æ	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	н	н	н	н	Н	н	н	н	н	Н
R3	Н	н	н	Ħ	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	н	Н	н	Н	Н	н	н	н	Ŧ	Н
Nr.	1.424	1.425	1.426	1.427	1.428	1.429	1.430	1.431	1.432	1.433	1.434	1.435	1.436	1.437	1.438	1.439	1.440	1.441	1.442	1.443	1.444

											44										
2	1,2,4-Triazol-1yl	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	Thiazolin-4,5-dion-2-yl	3-0xo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-yl	2-0xo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl	2-Thienyl	3-Thienyl	2-Furyl	3-Furyl	3-Methyl-isoxazol-5-yl	5-Thiazolyl	4-Thiazolyl	2-Thiazolyl	3-Methyl-isothiazol-5-yl	3-Isoxazolyl	5-Phenyl-thiazol-2-yl	2-Pyridyl	3-Pyridyl	4-Pyridyl	1-Methyl-2-pyrrolyl
X	CN	CN	CN	CN	CN	CN	Н	Н	Н	н	H	н	H	Æ	H	H	H	н	H	H	Н
7	SO ₂ CH ₃	SO,CH ₃	SO,CH ₃	SO ₂ CH ₃																	
R5	E	H	Ξ	Ħ	H	H	Ξ	Ξ	H	H	Ξ	E	=	=		=	=	=	=	五	上
R4	æ	Œ	æ	H	E	H	E	Ξ	Œ	Ξ	=	=		: =	=	: =	=	=	_=	=	王
R3	Œ	æ	=	=	=	=	Ξ	≖	E	_	=	_=	: =	<u>.</u>	: =	: =	1=	=	= =	: =	Ξ
Nr.	1.445	1.446	1 447	1 448	1.449	1.450	1.451	1.452	1.453	1.454	1 455	1 456	1 457	1027	1 450	1 460	1 461	1 462	1.463	1 464	1.465

	_
•	-
-	_

ı		_	_					_		,		45		_			·						_
2	1-Methv1-1.2.4-triazo1-5-**1	2-Benzthiazolvi	2-Chinolinyl	1-Methyl-benzimidazol-2	2-0xazolv1	1-Phenyl-pyrazol-5-vl	1-Methyl-pyrazol-3-v1	1-Methyl-pyrazol-5-vl	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-v.	1-Phenvl-nvrazol-3-v1	1.4-Dimothyl=nyrasol F	1 2-Dimetry 1 pyrazo1-5-y1	1,3-Dimetnyl-pyrazol-4-yl	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl	1-Methyl-pyrazol-4-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-vl	4-Methyl-oxazol-2-v1	5-Methylthio-thiazol-2-v1	4-Methoxv-1-methyl-myrazol_f=	3-Cyclobropy1-isoxa201-5-y1	3-Isopropyl-isoxazol-5-vl	(3-Methyl-phenyl)-thisacl-2	IA-7-10201117-1141114 This ::
Σ	H	Н	Н	Ξ	H	H	н	н	Ξ	н	H	я			Н	н	H	H	Н	H	H	н	
13	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	SO-CH-	20,000	SO ₂ CH ₃																		
RS	三	Ξ	王	H	Ξ	Ξ	H	н	н	Ξ	H	E	ı ı	: :	E	н	Н	Н	H	H	H	H	
R4	Ŧ	Н	H	Ξ	æ	н	н	Н	H	H	H	H	I			H	н	н	H	E	=	I	
R³	Н	H	н	н	Н	Н	Н	Н	н	н	H	=	-			Ξ	Н	H	H	=	H	H	
Nr.	1.466	1.467	1.468	1.469	1.470	1.471	1.472	1.473	1.474	1.475	1.476	1.477	1.478	1 470	77.5.7	1.480	1.481	1.482	1.483	1.484	1.485	1.486	

BNSDOCID: <WO 962620041 L >

			ſ			
Nr.	 	R4	R5	L	Ε	Noth: 1-th: 2201-2-v]
1.487	=	H	±	SO ₂ CH ₃	H	- T - TORRITATION - C
Τ]=	-	E	SO ₂ CH ₃	н	4-Brom-2-tnlenyı
				SOCH	H	5-Methyl-2-thienyl
1.489			1	20,200	п	4-Methyl-2-thienyl
1.490		H	H	SO ₂ CH ₃		1-Nothyl-thiazol-2-vl
1.491	H	H	I	SO ₂ CH ₃	H	4-Mechy chicago - 3
1.492	E	H	н	SO ₂ CH ₃	н	4-Cnior-unazor 2-y1
1.493	×	E	H	SO ₂ CH ₃	Н	4,5-Dimetny1-tniazo1-z-y1
1 494	=	H	Ξ	SO2CH3	Н	4-Phenyl-thiazo1-2-yı
1 495	=	Œ	H	SO ₂ CH ₃	н	2-Methoxy-thiazol-5-Y1
200	: :	2]=	SO,CH1	H	4-Methyl-2-pyridyl
1.496	=	=		SU-Ca	H	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl
1.497	Н	=	=	SU2CH 3		6-Methylthio-2-pyridyl
1.498	н	7 2.	н	SO ₂ CH ₃	<u> </u>	C state out - 2 - more do.
1.499	E	三	Н	SO ₂ CH ₃	H	6-Mecnoxy-3-py+1dy+
1	Ξ	=	E	SO ₂ CH ₃	Н	6-Methoxy-2-pyriayı
	<u> </u>	_=	=	SO,CH,	Ξ	6-Methyl-2-pyridyl
1.501	=			יאטיטש	×	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl
1.502	H	크		3020113	1 2	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl
1.503	H	Œ	Ħ	SO ₂ CH ₃	u	7 5
1 504	=	Ξ	H	SO ₂ CH ₃	H	5-Fyrmathy.
	1.	=	=	SO ₂ CH ₃	H	6-Dimethylamino-3-pyridyl
1.303	<u> </u>		=	SO,CH,	н	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1.500	=			מטיעם.	X	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.507	픠		듸	302cn3		

_		-, -									4	7									
2	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl	2-Pyrimidinyl	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl	5-Methyl-oxazol-2-yl	5-Pheny1-oxazo1-2-y1	2-Methyl-oxazol-5-yl	2-Phenyl-oxazol-5-yl	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl	2-Pheny1-1, 3, 4-oxa-diazol-5-yl	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	5-Methy1-1,2,4-oxadiazo1-3-y1	5-Pheny1-1, 2, 4-oxadiazo1-3-y1	5-Phenyl-isoxazol-3-yl	1-(4-Chlorphenyl)-1,2,4-triazol-2-yl	5-Cyano-4, 5-di-hydro-isoxazol-3-yl	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl	1,3-Dithiolan-2-y1	1,3-Dioxolan-2-y1
Σ	н	н	Н	Н	Н	н	H	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н
1	SO ₂ СН ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
R5	Н	Н	Н	H	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	н	н	Н	Н
R4	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	н	Н	Н	Н	н	н	Н	н
R ³	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	н	Н	н	н	Н	н	Н	æ	H	Н	Ħ
Nr.	1.508	1.509	1.510	1.511	1.512	1.513	1.514	1.515	1.516	1.517	1.518	1.519	1.520	1.521	1.522	1.523	1.524	1.525	1.526	1.527	1.528

BMCDOCID- NATO GENERADA I -

R3 R4 R5 H <th></th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th> <th></th>							
H H B SO2CH3 H H H H SO2CH3 H H H H H H H H H H H H H H SO2CH3 H H CH3 H <td></td> <td></td> <td></td> <td></td> <td>1</td> <td>Σ</td> <td>7.</td>					1	Σ	7.
H H SO ₂ CH ₃ H H H SO ₂ CH ₃ H H H H H H H H H H H H H H H H H H H H H CH ₃ H H H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H		T	=	=	SO,CH3	H	1,3-Dithian-2-yl
H H H SO2CH3 H H H H SO2CH3 H H H H H H H H H H H H H H SO2CH3 H H H H H SO2CH3 H H CH3	1.323	1		: =	SO,CH,	H	1,3-Dioxan-2-yl
H H H SO2CH3 H CH3 H H SO2CH3 H	┪	7	:		6 7 CH	H	1,3-Oxathiolan-2-yl
H H SO ₂ CH ₃ H H H SO ₂ CH ₃ H H H H SO ₂ CH ₃ H H H SO ₂ CH ₃ H H H H SO ₂ CH ₃ H H H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H H			E.	E	อบรูนตร		1 0 4-0-1-101
H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H	1.532	H	н	Œ	SO ₂ CH ₃	H	1,2,4-1110601 47.
H H SO2CH3 H H H SO2CH3 H H H SO2CH3 H H H SO2CH3 H CH3 H SO2CH3 H H CH3 H H SO2CH3 H CH3 H H SO2CH3 H CH3 H H SO2CH3 H CH3 H SO2CH3 <td>1.533</td> <td>H</td> <td>H</td> <td>Ξ</td> <td>SO₂CH₃</td> <td>H</td> <td>3-Methyl-1,2,4-tniddiazoi-3-yı</td>	1.533	H	H	Ξ	SO ₂ CH ₃	H	3-Methyl-1,2,4-tniddiazoi-3-yı
H H SO ₂ CH ₃ H H H SO ₂ CH ₃ H H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃	1.534	E	I	Ħ	SO ₂ CH ₃	Н	1,2,4-Thiadiazol-5-y1
H H SO ₂ CH ₃ H H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H	1.535	H	Œ	æ	SO ₂ CH ₃	н	Thiazolin-4,5-dion-2-y1
H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃	1,536	Ξ	I	Ξ	SO ₂ CH ₃	н	3-0x0-3-H-1,2,4-d1-tn1azo1-5-y1
CH3 H H SO2CH3 H CH4 H SO2CH3 H H CH4 H SO2CH3 H H CH4 H SO2CH3 H H	1.537	Œ	æ	Ξ	SO ₂ CH ₃	Н	2-0xo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-Y1
CH3 H SO2CH3 H CH3 H H SO2CH3 H CH4 H SO2CH3 H H CH4 H SO2CH3 H H	1 538	CH.	ıπ	=	SO ₂ CH ₃	Н	2-Thienyl
CH3 H SO2CH3 H CH3 H H SO2CH3 H CH4 H SO2CH3 H H	200		; n	=	SO,CH,	н	3-Thienyl
CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H SO ₂ CH ₃ H SO ₂ CH ₃ H SO ₂ CH ₃ H	1.339				SO ₂ CH ₂	H	2-Furyl
CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H	1.540	<u>.</u>	=		5020113	12	3-Furvl
CH3 H SO2CH3 H CH3 H H SO2CH3 H CH3 H H SO2CH3 H CH4 H SO2CH3 H H	1.541	E	エ	H	SO ₂ CH ₃	u	2 3 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4 4
CH3 H SO2CH3 H CH3 H H SO2CH3 H	1.542	뜐	H	H	SO ₂ CH ₃	×	3-Metny1-1s0xazo1-3-y1
CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H	1.543	ਲਿੱ	E	三	SO ₂ CH ₃	Н	5-Thiazoly1
CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H	1 544	É	E	H	SO ₂ CH ₃	н	4-Thiazolyl
CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H	242	į	1=	=	SO ₂ CH ₃	н	2-Thiazolyl
CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H	1.040		= =	=	SO,CH,	н	3-Methyl-isothiazol-5-yl
CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H CH ₃ H SO ₂ CH ₃ H	1.040		<u> </u>		en.CH.	H	3-Isoxazolyl
CH ₃ H H SO ₂ CH ₃ H	1.547	<u></u>			20.00	a	5-Phenyl-thiazol-2-yl
CH, H H S0 ₂ CH ₃ H	1.548	CH ₃	Ξ	E	SU2CH3		0_0.001401
	1 549	H	Ξ	Н	SO ₂ CH ₃	Œ	2-ryt 14y1

_							- .				4	9										
2	3-Pyridy1	4-Pyridyl	1-Methyl-2-pyrrolyl	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl	2-Benzthiazolyl	2-Chinolinyl	1-Methyl-benzimidazol-2-yl	2-Oxazolyl	1-Phenyl-pyrazol-5-yl	1-Methyl-pyrazol-3-yl	1-Methyl-pyrazol-5-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl	1-Phenyl-pyrazol-3-yl	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl	1-Methyl-pyrazol-4-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl	4-Methyl-oxazol-2-yl	5-Methylthio-thiazol-2-yl	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl	
Σ	Н	н	Ŧ	н	x	H	Н	H	Н	Н	H	Н	H	н	Н	H	==	н	н	H	н	
L	SO ₂ CH ₃	SO_2CH_3	SO ₂ CH ₃	SO2CH3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	so ₂ сн ₃															
RS	Ħ	н	H	Ξ	н	Н	Н	Н	н	Н	н	н	н	Н	Н	Н	Н	H	н	H	Н	
R4	н	H	Н	Ħ	н	н	Н	Н	н	н	н	Н	н	Н	H	Н	Н	æ	H	Ξ	H	
R.3	СН3	CH ₃	СН3	CH ₃	CH ₃	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	CH ₃	СН3	
Nr.	1.550	1.551	1.552	1.553	1.554	1.555	1.556	1.557	1.558	1.559	1.560	1.561	1.562	1.563	1.564	1.565	1.566	1.567	1.568	1.569	1.570	

RNSDOCID- >WO GESESONAT I >

1	100	50		Σ	2
2	<u>*</u>	<u>}</u>	10 00 00 00 00 00 00 00 00 00 00 00 00 0	#	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl
CH ₃	=	E	302cn3	: #	3-Isopropy1-isoxazol-5-yl
СН3	Ξ	Ξ	SO ₂ CH ₃		(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl
CH ₃	н	Ξ	SO ₂ CH ₃	= :	5-Wethyl-thiazol-2-yl
CH ₃	Ξ	н	SO ₂ CH ₃	H	A_brom_2-thienvl
£	E	Ξ	SO ₂ CH ₃	H	4-broil s circus-
E.	三	=	SO ₂ CH ₃	Н	5-Mecily1-2 circuit
E.	프	Ξ	SO ₂ CH ₃	н	4-Mecny1-2 cm:cm;-
E.H.	三	三	SO ₂ CH ₃	H	4-Methyl-thiasol-2-vl
품	三	三	SO ₂ CH ₃	H	4-Cnicasor # 3-
E	Ξ	Ξ	SO ₂ CH ₃	Н	4,5-Dimethy chicago
E	Ξ	王	SO ₂ CH ₃	Ξ.	4-FREILY I - CITAGOT I -
GH ₃	Ξ	エ	SO ₂ CH ₃	H	Z-Mellioxy circusor z
용	Ξ	Ħ	SO ₂ CH ₃	H	c-(2-wethowvethv1)-2-pyridy1
E.	E	н	SO ₂ CH ₃	H	6-(2-memory)
E.E.	E	Ξ	SO ₂ CH ₃	H	o methow-3-norido]
E	Ξ	三	SO ₂ CH ₃	H	o-meritory or present
\\ E	= =	三	SO ₂ CH ₃	Н	6-Metnoxy-z-pyrtuyı
7		=	SO2CH3	Н	6-Methyl-Z-pyridyl
1.300 1.500 1.500	_	=	SO ₂ CH ₃	H	6-(2,2,2-Tritiuor-etnoxy)-2-pyridy1
\top	1	田	SO ₂ CH ₃	Н	6-(2, 2, 2-Trit Luor-echoxy) - 3 Print
T	=	I	SO ₂ CH ₃	H	5-Pyr imidiny i

מאופחחרות: אווח מבסבסתת 1 1 -

		_									5	1									
2	6-Dimethylamino-3-pyridyl	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	3-Ethoxycarbony1-1-methy1-pyrazo1-5-v1	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl	2-Pyrimidinyl	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl	5-Methyl-oxazol-2-yl	5-Phenyl-oxazol-2-yl	2-Methyl-oxazol-5-yl	2-Phenyl-oxazol-5-yl	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl	2-Phenyl-1, 3, 4-oxa-diazol-5-yl	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	5-Phenyl-isoxazol-3-yl	1-(4-Chlorphenyl)-1,2,4-triazol-2-yl	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl
M	Н	н	Н	#	H	Н	H	H	н	н	H	н	н	н	н	Н	Н	н	Н	Н	Н
ī	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
RS	Ξ	Ξ	н	н	н	Ξ	н	Н	Н	Н	Н	н	Н	H	H	н	Н	Н	н	Н	Ξ
R4	田田	Н	Н	Н	Н	Ħ	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	н	Н	H
R3	СН3	СН3	СН3	СН3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	СН3	CH ₃	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3						
Nr.	1.592	1.593	1.594	1.595	1.596	1.597	1.598	1.599	1.600	1.601	1.602	1.603	1.604	1.605	1.606	1.607	1.608	1.609	1.610	1.611	1.612

	Fa Ca	R4	RS	1	Σ	2
NI.	1			SO2CH3	Н	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl
\top	\top	:] =		SO,CH,	н	1,3-Dithiolan-2-y1
7	十	1		SO,CH,	Ŧ	1,3-Dioxolan-2yl
1.615	寸	1	1	20 GE	ח	1.3-Dithian-2-yl
1.616	GH3	H	<u>=</u>	SO ₂ CH ₃	u	1 2 Diovan-2-v]
1.617	CH3	Н	H	SO ₂ CH ₃	Н	I, 3-Dioxaii & Ji
1.618	CH3	Ξ	н	SO ₂ CH ₃	Н	1,3-Oxatn101dn-2-yı
1.619	CH3	Ξ	H	SO ₂ CH ₃	Н	1, 2, 4-Triazol-1y1
1.620	CH.	E	H	SO ₂ CH ₃	Н	3-Methyl-1, 2, 4-tnladiazoi-3-yı
1 621	E.	×	E	SO ₂ CH ₃	Н	1,2,4-Thiadiazol-5-yl
1 622	E.	I	Ξ	SO ₂ CH ₃	Н	Thiazolin-4,5-dion-2-y1
1.022	(II)	: =	Ξ	SO,CH,	H	3-0xo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-yl
1.623	Eu3	: :	: :	SO.CH.	E	2-0xo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl
1.624	CH3	=		2020113	5	2-Thienvl
1.625	CH ₃	I	Н	SO ₂ CH ₃	73	J. 1914 (1999)
1.626	CH,	Ħ	Н	SO ₂ CH ₃	CJ	3-Inlenyı
1.627	ĞĦ,	≖	三	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
1 628	£	=	三	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
1 620	É	=	=	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.022		=	_=	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazoly1
1.030			=	SO,CH3	C1	4-Thiazolyl
1.031		= =	=	SO,CH3	CI	2-Thiazolyl
1.032		: :		SO.CH.	C1	3-Methyl-isothiazol-5-yl
1.633	£					

	_	_	_		_	 -	_	_	_		5.	3		_	·	_	_				
2	3-Isoxazolyl	5-Phenyl-thiazol-2-yl	2-Pyridyl	3-Pyridyl	4-Pyridyl	1-Methyl-2-pyrrolyl	1-Methyl-1, 2, 4-triazol-5-yl	2-Benzthiazolyl	2-Chinoliny1	1-Methyl-benzimidazol-2-yl	2-Oxazolyl	1-Phenyl-pyrazol-5-yl	1-Methyl-pyrazol-3-yl	1-Methyl-pyrazol-5-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl	1-Phenyl-pyrazol-3-yl	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl	1,3-Dimethy1-pyrazol-4-yl	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl	1-Methyl-pyrazol-4-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl
Σ	c1	c1	C1	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl	Cl	C1	C1	Cl	Cl	C1	ເ1	Cl	C1	C1	C1	c1	C1
L	SO ₂ CH ₃	SO ₂ СН ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO_2CH_3	SO_2CH_3	SO_2CH_3	SO_2CH_3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO_2CH_3	SO ₂ CH ₃								
R5	Н	Н	Н	н	Н	Н	н	Н	Н	Н	н	н	н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н
R4	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	н	Н	Н	Н	Н	Н	H
R ³	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	CH3	СН3	CH3	СН3	СН3	СН3	СНЭ	СН3	СН3	СН3						
Nr.	1.634	1.635	1.636	1.637	1.638	1.639	1.640	1.641	1.642	1.643	1.644	1.645	1.646	1.647	1.648	1.649	1.650	1.651	1.652	1.653	1.654

RNSDOCID: >WO GEREROLAT I >

			Ī			
Nr.	R ³	R4	R ⁵	J.	Ε	
1 655	15 15	=	=	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazo1-2-yı
1	十	,	=	SO,CH,	C1	5-Methylthio-thiazol-2-yl
一	十		T	-HJ-05	C1	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl
1.657	СН3	<u>.</u>	<u> </u>	Sozens		1-Cvclonropv1-isoxazo1-5-yl
1.658	CH3	н	æ	SO ₂ CH ₃	CI	- Cyclograph
1.659	CH3	E	H	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isopropy1-Isoxaco1-5 fr
Т	1	H	Ξ	SO ₂ CH ₃	C1	(3-Methyl-phenyl)-thiazoi-4-yi
1 661	CH.	H	Ξ	SO ₂ CH ₃	[2]	5-Methyl-thiazol-z-yı
1 663	Ę	Ξ	=	SO ₂ CH ₃	C1	4-Brom-2-thienyl
1.002	ָרָ בָּי בּי	: 2	Ξ	SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-2-thienyl
1.003		: =] =	SOCH	C1	4-Methyl-2-thienyl
1.664	£			G10.200	[2]	4-Methyl-thiazol-2-yl
1.665	CH3	Ξ	H	SU ₂ CH ₃	5 8	4-chlor-thiazo1-2-y1
1.666	CH3	エ	H	SO ₂ CH ₃	3	1 C Stanthyl-thiazol-2-vl
1.667	G.	三	H	SO ₂ CH ₃	C1	4,5-Dimeriyi-ciitazor 2,1
1 668	É	=	E	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pheny1-th1azo1-2-y1
2001	É	=	=	SO ₂ CH ₃	C1	2-Methoxy-thiazol-5-y1
1.007			=	SO,CH,	C1	4-Methyl-2-pyridyl
1.0/0		<u> </u>		SO.CH.	C1	6-(2-Methoxyethy1)-2-pyridy1
1.671	É	=	= :	5070G	[5]	6-Methylthio-2-pyridyl
1.672	CH ³	三	=	SU2CH3	5 5	6-Methoxy-3-pyridyl
1.673	CH3	王	Ħ	SO ₂ CH ₃	5	C Mathamas 2 - Dayridy]
1.674	GH.	Ξ	H	SO ₂ CH ₃	13	0-Meclioxy-z pyrrojr
1 675	É	Ξ	트	SO ₂ CH ₃	C1	6-Methy1-2-pyridyi
			1			

_											5	,									
2	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl	5-Pyrimidiny1	6-Dimethylamino-3-pyridyl	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl	2-Pyrimidinyl	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl	5-Methyl-oxazol-2-yl	5-Phenyl-oxazol-2-yl	2-Methyl-oxazol-5-yl	2-Phenyl-oxazol-5-yl	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl	2-Phenyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	5-Phenyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl
X	C1	C1	c1	C1	C]	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C 1	C1	C1	C1	C1	C1	C1
ī	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	so ₂ сн ₃
R5	Н	Н	н	H	н	Н	H	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	H	н	Н	Н	Н	Н	Ή
R4	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	н	Н	н	Н	н	Н	н	Н	н	н	н	н	Н
R ³	СН3	CH ₃	СН3	СН3	СН3	CH3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	CH ₃	СН3	СН3	СН
Nr.	1.676	1.677	1.678	1.679	1.680	1.681	1.682	1.683	1.684	1.685	1.686	1.687	1.688	1.689	1.690	1.691	1.692	1.693	1.694	1.695	1.696

BNSDOCID: <WO 9626200A1 I >

_				Т	1	\neg	\neg	Т			T	T	6			Т	7	丁	\neg			T	Т	\neg		
Z	5-Phenyl-isoxazol-3-yl	1-(4-Chlorphenyl)-1,2,4-triazol-2-yl	E-Cusho-4 5-di-hvdro-isoxazol-3-vl	3-Cyano 4/3 cr 4 3 ch in in 2 ch in	5,6-Dinydro-4H-1,3-miazin-z-yi	1,3-Dithiolan-2-y1	1,3-Dioxolan-2y1	1,3-Dithian-2-y1	1,3-Dioxan-2-yl	1 3-Oxathiolan-2-yl	· · · · · · · · · · · · · · · · · · ·	1,2,4-1114201-191	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-y1	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	mh: 2201:n-4 5-dion-2-v]	TITOTOTILITY OF THE TOTAL TOTA	3-0x0-3-H-1,2,4-d1-tn1d201-3-y1	2-0xo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl	2-Thienyl	3-Thienyl		Z-Furyı	3-Furyl	3-Methyl-isoxazol-5-yl	5-Thiazolyl	
Σ	C1	[]	į,	C1	C1	C1	C1	c1	[3]	5	15	C1	C1	5		C1	C1	C]	CH ₃	CH3	Ç3	СН3	CH ₃	CH3	E	C11.3
-	C'R'			SO_2CH_3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SOCH	(m. 700	SU2Ch3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	- LO 05	SU2CH3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH3	SO ₂ CH ₂	5700	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH3	SO,CH,	110 OF	SO ₂ CH ₃
50		1	<u> </u>	=	H	=	=		1	eg	H	н]=		Ξ	Н	E	I	2	= ;	Н	H	=			<u>=</u>
24			<u> </u>	I	E	=	=	: :	. :	=	Œ	H]:		Н	Н	=	2	: :	=	王	三]=			Ξ
	\neg	_	СН3	CH3	CH3	É	į		E E	CH ₃	CH3	CH.		CE3	CH3	GH3	Ę	<u> </u>		£	CH ₃	Ë	É			£ E
	7	1.697	1.698	1.699	1.700	1 701	1 702	1.704	1.703	1.704	1.705	1.706		1.70/	1.708	1.709	1 710	7 7 7 7	11/11	1.712	1.713	1 714	7 2 2	1.713	1./16	1 717

Nr.	R3	R4	R5	1	Σ	2
1.718	СН3	н	н	SO ₂ CH ₃	СН3	4-Thiazolyl
1.719	СН3	н	н	SO ₂ CH ₃	СН3	2-Thiazolyl
1.720	CH ₃	н	н	SO ₂ CH ₃	СН3	3-Methyl-isothiazol-5-yl
1.721	СН3	H	н	SO ₂ CH ₃	СН3	3-Isoxazoly1
1.722	CH3	Н	н	SO ₂ CH ₃	CH ₃	5-Phenyl-thiazol-2-yl
1.723	СН3	Ξ	æ	SO ₂ CH ₃	СН3	2-Pyridyl
1.724	СН3	H	H	SO ₂ CH ₃	СН3	3-Pyridyl
1.725	СН3	н	н	SO ₂ CH ₃	СН3	4-Pyridyl
1.726	СН3	н	Н	SO ₂ CH ₃	CH ₃	1-Methyl-2-pyrrolyl
1.727	CH ₃	н	Н	SO ₂ CH ₃	СН3	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl
1.728	СН3	н	Н	SO ₂ CH ₃	СН3	2-Benzthiazolyl
1.729	CH ₃	Н	н	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Chinolinyl
1.730	СН3	Н	н	SO ₂ CH ₃	СН3	1-Methyl-benzimidazol-2-yl
1.731	СН3	Н	Н	SO ₂ CH ₃	СН3	2-Oxazolyl
1.732	CH ₃	н	Н	SO ₂ CH ₃	СН3	1-Phenyl-pyrazol-5-yl
1.733	CH ₃	Н	Н	SO ₂ CH ₃	СН3	1-Methyl-pyrazol-3-yl
1.734	CH3	Н	Н	SO ₂ CH ₃	СН3	1-Methyl-pyrazol-5-yl
1.735	CH ₃	н	Н	SO ₂ CH ₃	СН3	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl
1.736	CH ₃	H	Н	SO ₂ CH ₃	СН3	1-Phenyl-pyrazol-3-yl
1.737	СН3	Н	Н	SO ₂ CH ₃	СН3	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl
1.738	СН3	Н	Н	SO ₂ CH ₃	СН3	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl

												58					_		_		-			٦
2	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl	1-Methyl-pyrazol-4-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl	4-Methyl-oxazol-2-yl	7	5-Metnyltnio-tniazor-z-yı	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl	3-Isopropy1-isoxazol-5-yl	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl	5-Methy1-thiazol-2-yl	4-Brom-2-thienyl	5-Methy1-2-thieny1	4-Methyl-2-thienyl	4-Methyl-thiazol-2-yl	1 Oblin hhimmil-2-vi	4-Cn10r-Linazor-2-y1	4,5-Dimethyl-thiazol-2-yl	4-Phenyl-thiazol-2-yl	2-Methoxy-thiazol-5-yl	4-Methyl-2-pyridyl	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl	6-Methylthio-2-pyridyl	
E	СН3	СН3	СН3	CH.	ćii.)	СН3	СН3	СН3	СН3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CHi	, and	Cm3	СН3	СН3	CH ₃	CH ₃	CH3	CH	1.5	ICH3
L	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SOCH	5	SU ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SOCH	ch. Za	3020113	SO ₂ CH ₃	SO,CH ₁	SOCH	Co-Zog	3020113	SO ₂ CH ₃									
R5	E	E			_	H	=	E	H	E	×	E	n n	; =	5	Ħ	Ξ	Ξ	E	I	= =		_	포
R4	=	T	1		H	н	=	E	Ξ	H	Ħ	Ξ		: :	=	H	Н	H	=	=			=	н
R3	£	Ĥ		CE3	CH3	CH3	CH3	CH3	CH3	CH3	CHi	Ę			5	CH3	CH3	£	E				CH ₃	CH3
Nr.	1.739	1 740	25,	1./41	1.742	1.743	1.744	1.745	1.746	1.747	1 748	1 740	7.17	1. /50	1.751	1.752	1.753	1 754	1 755	1 756	1: / 50	1.75/	1.758	1.759

_			Γ				Π				39											
2	6-Methoxy-3-pyridyl	6-Methoxy-2-pyridyl	6-Methyl-2-pyridyl	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl	5-Pyrimidiny1	6-Dimethylamino-3-pyridyl	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl	2-Pyrimidinyl	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl	5-Methyl-oxazol-2-yl	5-Pheny1-oxazo1-2-y1	2-Methyl-oxazol-5-yl	2-Phenyl-oxazol-5-yl	2-Methy1-1,3,4-oxa-diazol-5-yl	2-Phenyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl	
W	снз	снэ	снз	снз	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	сн₃	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	снз	сн₃	сн₃	сн₃	
L	SO_2CH_3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	so ₂ сн ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO_2CH_3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ СН ₃	SO ₂ CH ₃				
R5	Н	Н	н	н	н	Н	Н	Н	н	Н	н	Н	н	Н	Н	н	Н	Ħ	I	Ħ	н	
R4	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	н	Н	Н	Н	н	н	Н	H	Ħ	三	н	
R³	СН3	CH ₃	CH3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	CH3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH3	CH ₃	
Nr .	1.760	1.761	1.762	1.763	1.764	1.765	1.766	1.767	1.768	1.769	1.770	1.771	1.772	1.773	1.774	1.775	1.776	1.777	1.778	1.779	1.780	

												60			_	_	_			_	_			_
2	5-Trifluormethy1-1,2,4-oxadiazo1-3-yl	5-Methyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	5-Pheny1-1, 2, 4-oxadiazol-3-yl	5-Phenvl-isoxazol-3-yl	1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1 1	1-(4-Chlorphenyl)-1,2,4-trldzol-2-yl	S-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl	5,6-Dihydro-4H-1,3-thiazin-2-yl	1,3-Dithiolan-2-yl	1,3-Dioxolan-2yl	1,3-Dithian-2-yl	1,3-Dioxan-2-y1	1,3-Oxathiolan-2-yl	1 2 4-mriazol-lvl		3-Methy1-1, 2, 4-tnladlazo1-5-y1	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	Thiazolin-4,5-dion-2-yl	3-0xo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-yl	2_000_0_U_1 2 4_dithiazol-5-vl	** C *********************************	2-Thienyl	3-Thienyl	2-Furyl
Σ	СН3	СН3	CH1	Çu.	Cn3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	CH ₃	CH ₃	CH3		Cn3	СН3	СН3	CH ₃	CH3		CH ₃	CH ₃	СН3	СН,
L	SO ₂ CH ₃	SO,CH3	SO-CH.	50.200 50.000	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO2CH3	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	HJ-US	3020113	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	CO.CH.	3020113	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	S0 ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
R5	=	-	1		H	H	E	H	H	H	I	7	: :	=	Œ.	H	=	=	: :	_	Ħ	E	æ	Œ
R4	1	1			Ξ Ξ	H	H	=	T	E	E	=			H	H	Ξ	= =		E	Н	£	E	É
R3		+	_	十	CH3	GH3	Æ	E	E.	CH3	£			CH3	CH_3	CH,	Ë	, E		СН3	СН3	E	É	
Nr	781	1			1.784	1.785	T	T	1.788	1.789	1 790	26.	1.791	1.792	1.793	1.794	1 705	1.000	1.790	1.797	1.798	1 799	1 000	1.000

1								-				61		_									
2	3-Furvl	3-Methy]-isoxazol-5-v;	5-Thiazoly!	4-Thiazolyl	2-Thiazolyl	3-Methyl-isothiazol-5-v1	3-Isoxazolvi	5-Phenv1-thiazol-2-v1	2-Pyridyl	3-Pyridyl	4-Pvridvl	1-Nother 2	1 Methyl 2 pylrolyl	1-mecny1-1,2,4-triazol-5-y1	2-Benzthiazolyl	2-Chinolinyl	1-Methyl-benzimidazo1-2-vl	2-0xazolv1	1-Phenv1-pvrazo1-5-v1	1-Methyl-nyrazol-3-::	1-Methyl-byrazol-5-v1	1,3-Dimethyl-nyrazol-2	TÅ_C_107011 F110701_3_ÅT
Σ	CH ₃	СН3	СН3	СН3	СН3	CH ₃	СН	GE				CH ₃	CH ₃	CH ₃	СН3	CH ₃		СН3					
L	SO ₂ CH ₃	SO2CH3	SO ₂ CH ₁	SO,CH,	SO, CH.	5112700	SU ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃															
RS	Ξ	H	王	Ξ	=	Ξ	H	æ	=	표	H	H	Œ	ī	: =	_	H	Œ	н	Œ	н	н	
R4	CH ₃	CH ₃	CH ₃	Œ.	CH3	CH3	CH3	СН3	CH ₃	CH3	CH3	CH3	GH,	÷		CE3	CH ₃	СН3	CH3	CH ₃	CH ₃	СН3	
R.3	СН3	CH ₃	CH ₃	СН3	CH ₃	СН3	СН3	СН3	CH ₃	СН3	CH ₃	GH3	CH,	Ğ.	, in	£	CH ₃	СН3	СН3	CH3	CH ₃	СН3	
Nr.	1.802	1.803	1.804	1.805	1.806	1.807	1.808	1.809	1.810	1.811	1.812	1.813	1.814	1.815	1 816	0101	1.817	1.818	1.819	1.820	1.821	1.822	

					Τ_	Τ-	1	Т		Т	62	T	Т	7			Γ		Τ	Т				1
2	1-phenyl-pyrazol-3-yl	1 4-Dimethyl-pyrazol-5-yl	1 2-nimethvl-pvrazol-4-yl	1, 3-Dimetris - F1	1,3-Ulmeriif Pi-li-	1-Metnyi-pyrazor - 1-	I,3-Dimetry Product	4-Mecny1-Ovazoz z z z z z z z z z z z z z z z z z z	5-Mechylenic chicago	4-Methoxy-1-methy-1-5-v1	3-Cyclopropy1_1sonacc	3-Isopropy1-1s0xazo1-5 fr	(3-Methyl-phenyl)-tnlazol-z-yl	5-Methyl-thiazol-2-yl	4-Brom-2-thienvl	5-Wothyl-2-thienvl	J-Mechy + Constant James J	4-Metny1-2-cn1cn11	4-Methyl-thlazol-2-yı	4-Chlor-thiazol-2-yl	4 5-Dimethyl-thiazol-2-yl	4_bhenv1_thiazo1-2-v1	4-Files 4 - Files 4 - Files 5 - File	Z-Methoxy-thrazor Jr
2	i no	Cn3	CH3	CH ₃	CH ₃	СН3	СН3	СН3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	EH.		CH3	CH ₃	CH ₃	СН3	CH		Cff3	CH ₃	CH ₃
			SO ₂ CH ₃	502СН3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SOCH	5	SO2CH3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	20 Ott	502cm3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃			
Γ		Ξ Σ	E .	H	H	H	H	ı =	H	E	Ξ	Ξ]:		Ξ	н	Н	Ξ	=		=	H	H	王
	24 E	CH ₃ F	CH ₃	CH ₃	E.E.	E 3	CH ₃	CH3	CH3	GH.	CH3	T		£	CH3	CH3	E.	£	į		ਲ <u>਼</u>	CH ₃	8	E.
t	²	CH ₃	CH ₃	GH3	GH ₃	E.	GH,	G.	CH3	CH ₃	£	Ę.		E	СН3	CH3	E.	E		<u> </u>	CH ₃	Œ.	표	ਲਿੰ
	Nr.	1.823	1.824	1.825	T	†	Τ	1.829	1.830	1.831	1 832	1 022	1.833	1.834	1.835	1.836	1.837	1 028	1.83	1.839	1.840	1.841	1.842	1.843

											63										
Z	4-Methyl-2-pyridyl	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl	6-Methylthio-2-pyridyl	6-Methoxy-3-pyridyl	6-Methoxy-2-pyridyl	6-Methyl-2-pyridyl	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl	5-Pyrimidinyl	6-Dimethylamino-3-pyridyl	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	3-Ethoxycarbonyl-1-methyl-pyrazol-5-yl	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl	2-Pyrimidinyl	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl	5-Methyl-oxazol-2-yl	5-Phenyl-oxazol-2-yl	2-Methyl-oxazol-5-yl
Σ	CH3	СН3	СН3	СН3	CH ₃	СН3	СН3	CH3	СН3	CH ₃	СН3	CH3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	СН3	СН3	CH ₃	CH ₃	СН3
1	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃						
R5	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	н	н	н	Ħ	H
R4	СН3	СН3	СН3	СН3	СНЭ	СН3	СН3	СНЭ	СН3	СНЭ	СН3	СНЭ	СН3	СН3	СН3	СНЭ	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3
R ³	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	снэ	СН3	СН3	СН3	СН3	CH ₃	CH3	CH3	CH ₃						
Nr.	1.844	1.845	1.846	1.847	1.848	1.849	1.850	1.851	1.852	1.853	1.854	1.855	1.856	1.857	1.858	1.859	1.860	1.861	1.862	1.863	1.864

				_	_		-	_	T		_	Т	4	_		_	Т	_	_		_	Т	Ŧ	٦		7
2	2-Phenyl-oxazol-5-yl	2-Methy1-1,3,4-oxa-diazol-5-yl	2-Pheny1-1,3,4-oxa-diazol-5-yl	s-mrifluormethvl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	J_IIIIIGE##C0::1 = -1-1-11	5-Methyl-1,2,4-0xadlazo1-3-y1	5-Pheny1-1, 2, 4-oxadiazol-3-y1	5-Phenyl-isoxazol-3-yl	1-(4-Chlorphenyl)-1,2,4-triazol-2-yl	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl	c c-nihwdro-4H-1 3-thiazin-2-v1		1,3-Dithiolan-2-y1	1,3-Dioxolan-2yl	1,3-Dithian-2-yl	1 2-Diovan-2-vl	1,3-V10Agii & 7±	1,3-0xathiolan-2-yl	1,2,4-Triazol-1yl	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl	1 2 4-mhiadiazol-5-v]	1,2,4-11110011001011	Thiazolin-4,5-dion-2-yl	3-0xo-3-H-1,2,4-di-thiazol-5-yl	12-0x0-7-H-1 3.4-dithiazol-5-yl	7 (20) 7
Σ	СН3	CH ₃	CH	G5	CH ₃	CH ₃	СН3	CH ₃	CH ₃	CH		CH3	CH3	CH ₃	CH		СН3	СН3	CH ₃	CH.		CH ₃	СН3	CH3	,	CH ₃
1.1	SO,CH,	SOCH	5:::270a	SO2Ch3	SO ₂ CH ₃	SOCH	C-707	aU2ch j	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	5::5755	302CB3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	500 Cm ²	502cm3	SO ₂ CH ₃	SO,CH3	CO.CH.	3020113	SO ₂ CH ₃			
25		T		1	=	H	=	Ξ.	1 2		E	×	E];	<u>.</u>	E	н	E			Ξ.	H	=	: :	=	Ξ
24	٦,		7	- E	CH ₃	£	+-	+	+	+	CH ₃	GH,	£	\top	5	CH3	CH3	Ę		£]	CH3	CH3	Ę		£	Œ
63			\neg	E 3	CH ₃	E.	1	1	_	\neg	СН3	CH3	£		£	CH ₃	GH	E.		E 3	CH3	£	, j		CH3	СН3
		1	1	1.867	1.868	\top		\top	T	T	1.873	1.874	1 075	7.017	1.876	1.877	1 878	070	1.875	1.880	1.881	1 882		1.883	1.884	1.885

_		_									0:		-									_
2	2-Thienyl	3-Thienyl	2-Furyl	3-Furyl	3-Methyl-isoxazol-5-yl	5-Thiazoly1	4-Thiazolyl	2-Thiazolyl	3-Methyl-isothiazol-5-yl	3-Isoxazoly1	5-Pheny1-thiazol-2-yl	2-Pyridyl	3-Pyridy1	4-Pyridyl	1-Methyl-2-pyrrolyl	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl	2-Benzthiazolyl	2-Chinolinyl	1-Methyl-benzimidazol-2-yl	2-0xazolyl	1-Phenyl-pyrazol-5-yl	· 100 - 100
Σ	13	13	13	C1	C1	C1	13	13	13	13	13	c1	CJ	ເວ	C1	C1	C1	Cl	Cl	C1	C1	
L	so ₂ сн ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	so ₂ сн ₃	so ₂ сн ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	502СН3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ СН ₃	SO ₂ CH ₃	so ₂ сн ₃	s0 ₂ сн ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO_2CH_3	SO_2CH_3	SO ₂ CH ₃	
R5	н	Н	Н	н	н	н	н	н	Н	н	H	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	
R4	СН3	СН3	СН3	СН3	CH ₃	СН3	СН3	СН3	СНЭ	СН3	СН3	СН3	CH3	СН3								
R ³	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	CH ₃	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	CH_3	СН3	СН3	СН3	CH3	
Nr.	1.886	1.887	1.888	1.889	1.890	1.891	1.892	1.893	1.894	1.895	1.896	1.897	1.898	1.899	1.900	1.901	1.902	1.903	1.904	1.905	1.906	

											66										
2	1-Methyl-pyrazol-3-yl	1-Methyl-pyrazol-5-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl	1-Phenyl-pyrazol-3-yl	1,4-Dimethyl-pyrazol-5-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-4-yl	1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yl	1-Methyl-pyrazol-4-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl	4-Methyl-oxazol-2-yl	5-Methylthio-thiazol-2-yl	4-Methoxy-1-methyl-pyrazol-5-yl	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl	3-Isopropyl-isoxazol-5-yl	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl	5-Methyl-thiazol-2-yl	4-Brom-2-thienyl	5-Methyl-2-thienyl	4-Methyl-2-thienyl	4-Methyl-thiazol-2-yl	4-Chlor-thiazol-2-yl
M	C1	C1	ເລ	13	C1	Cl	C1	C 1	C1												
ī	SO ₂ CH ₃																				
R5	H	H	H	H	н	н	н	H	Ξ	H	Ħ	×	ェ	Ξ	Ξ	Ŧ	Ŧ	Ξ	王	Ħ	H
R4	CH ₃	CH3	CH3	CH ₃	CH ₃	CH3	CH3	CH ₃	CH3	CH.)	CH ₃	CH3	GH ₃	CH ₃	CH ₃	CH3	GH3	GH3	£	GH3	£
R3	CH3	CH ₃	CH ₃	CH3	CH3	CH3	CH3	CH ₃	CH3	CH3	CIII	GH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH ₃	EH3	₩.	£	GH ₃	GH.
Nr.	1.907	1.908	1.909	1.910	1.911	1.912	1.913	1.914	1.915	1.916	1.917	1.918	1.919	1.920	1.921	1.922	1.923	1.924	1.925	1.926	1.927

_	ı		-	_	1		_	T	7	_	6	7 7 —									
2	4,5-Dimethyi-thiazol-2-yl	4-Phenyl-thiazol-2-yl	2-Methoxy-thiazol-5-yl	4-Methyl-2-pyridyl	6-(2-Methoxyethyl)-2-pyridyl	6-Methylthio-2-pyridyl	6-Methoxy-3-pyridyl	6-Methoxy-2-pyridyl	6-Methyl-2-pyridyl	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl	5-Pyrimidinyl	6-Dimethylamino-3-pyridyl	1,2,4-Thiadiazo1-5-yl	3-Ethoxycarbony1-1-methyl-pyrazol-5-yl	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl	2-Pyrimidinyl	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl
Σ	C1	C1	C1	C1	C1	C1	C1	12	C1	C1	C1	C1									
ī	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃									
RS	н	Н	Н	н	H	Н	Н	н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	н
R4	СН3	СН3	СН3	СНЭ	CH ₃	СН3	СНЭ	СН3	CH3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3
В3	СН3	CH ₃	CH ₃	СН3	СН3	CH3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3
Nr.	1.928	1.929	1.930	1.931	1.932	1.933	1.934	1.935	1.936	1.937	1.938	1.939	1.940	1.941	1.942	1.943	1.944	1.945	1.946	1.947	1.948

RNSDOCID: <WO 9626200A1 I >

													68									_				1
2	5-Methyl-oxazol-2-yl	5-Phenyl-oxazol-2-yl	2_Worthyl_Cyazol_5-v1	Z-Mechyl-Ovazor o r.	2-Phenyl-oxazol-5-yl	2-Methy1-1,3,4-oxa-diazol-5-y1	2-Pheny1-1, 3, 4-oxa-diazol-5-yl	5-Trifluormethyl-1,2,4-oxadiazol-3-yl	5-Mothv1-1 2 4-oxadiazol-3-v1		5-Pheny1-1, 2, 4-0xad1az01-3-y1	5-Phenyl-isoxazol-3-yl	1-(4-Chlorpheny1)-1,2,4-triazol-2-yl	5-Cyano-4,5-di-hydro-isoxazol-3-yl	r / n:h:.d-n-1 2-thiszin-2-v1	5,6-Dinyaro-4n-1,3-Chiazin z Ji	1,3-Dithiolan-2-yl	1,3-Dioxolan-2yl	1,3-Dithian-2-yl	1,3-Dioxan-2-y1	1	1,3-0xatn101an-2-yı	1,2,4-Triazol-1yl	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl	1.2.4-Thiadiazol-5-yl	
>	C1	[3]		C1	C1	C1	c1	C1	23	C.1	C1	c1	C1	[]	1	C1	C1	C1	C1	[2		C1	C1	C1	1.5	12
	go.CH.	202013	SU2CH3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	CO. Cu.	30200	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SOCH	(112.70g	302Cft3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	מט עמי	aU2Cn3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₂	10 00	SO ₂ CH ₃
35	T		Ę	Œ	H	н	=		_	I	Н	Ξ	7		H	H	王	=	=	<u>. </u>	H	H	=	=		
	_	\neg	É	CH3	GH3	ਲੌ	É		£3	CHJ	CH3	CH.	5 5	<u> </u>	СН3	CH3	CHr	£	É		CH3	ਲੌ	É	1 2		£
			CH ₃	CH3	CH.3	1-	丁		CH3	CH3	GH3	H		£ 5	СН3	CH3	H	É			CH ₃	E	· £			GH ₃
		寸	1.950	1.951	1.952	T	T		1.955	1.956	1.957	1 058	1.330	1.959	1.960	1.961	1 962	1 062	1.303	1.304	1.965	1.966	1 067	1.307	1.908	1.969

_		<u> </u>									0:										
7	Thiazolin-4,5-dion-2-yl	3-0xo-3-H-1, 2, 4-di-thiazol-5-yl	2-0xo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-yl	2-Thienyl	3-Thienyl	2-Furyl	3-Fury1	3-Methyl-isoxazol-5-yl	5-Thiazolyl	4-Thiazolyl	2-Thiazolyl	3-Methyl-isothiazol-5-yl	3-Isoxazoly1	5-Phenyl-thiazol-2-yl	2-Pyridy1	3-Pyridyl	4-Pyridyl	1-Methyl-2-pyrrolyl	1-Methyl-1,2,4-triazol-5-yl	2-Benzthiazolyl	2-Chinolinyl
Σ	C1	C1	C1	H	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	I	Н	Н
Т	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	so ₂ cH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃
RS	н	н	н	Н	н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	н	н	н	Н	Н	н
R ⁴	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СНЭ	СН3	СН3	СНЭ	СН3	СН3	CH3	СН3	СН3
R ³	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СНЭ	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	CH3	СН3	СН3	СН3
Nr.	1.970	1.971	1.972	1.973	1.974	1.975	1.976	1.977	1.978	1.979	1.980	1.981	1.982	1.983	1.984	1.985	1.986	1.987	1.988	1.989	1.990

2	1-Methyl-benzimidazol-2-yl	2-Oxazolyl	1-Phenyl-pyrazol-5-yl	1-Methyl-pyrazol-3-yl	1-Methyl-pyrazol-5-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-3-yl	1-Phenyl-pyrazol-3-yl	1.4-Dimethyl-pyrazol-5-yl	1 3-Dimothyl-nyrazo]-4-v]		1,5-Dimethyl-pyrazol-4-yı	1-Methyl-pyrazol-4-yl	1,3-Dimethyl-pyrazol-5-yl	4-Methyl-oxazol-2-yl	5-Methylthio-thiazol-2-yl		4-Methoxy-1-methy1-py1azo1-3-y1	3-Cyclopropyl-isoxazol-5-yl	3-Isopropyl-isoxazol-5-yl	(3-Methyl-phenyl)-thiazol-2-yl	5-Methyl-thiazol-2-yl	4-Brom-2-thienyl	5-Methvl-2-thienyl
Σ	H	H	H	H	H	H	Ξ.	a		н	Ŧ	H	æ	н		G.	Н	н	н	H	H	Ξ	12
-1	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	SO,CH,	SO,CH ₃	SO,CH,	SO ₂ CH ₃	Sup 700	SU2CH3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SOCH	SO-CH-	50,2013	SO ₂ CH ₃	SO2CH3	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃				
RS	H	E	=	Ξ	Ħ	: =	:] =	: :		I	ェ	Ξ.]=	: :		Ξ	н	三	=	1=	=	=	
R4	EH.	É	É	E	GH.	CH.			£	CH3	Ğ.	ੰ			5	CH ₃	ਚੌ	£	É	É	Ð	É	
69		1		1	(ii)			CH3	CH3	СН3	CH,	£.			£	CH3	ਲੁ	É	É	É	É	E	
32	991	T	1	\top	1.005	1.333	1.330	1.99/	1.998	1.999	1.1000	1 1001	1.1001	1.1002	1.1003	1.1004	1.1005	1 1006	1 1007	1008	1000	1010	1:1010

_	_	_		-		_	_	_	_		7	1									
2	4-Methyl-2-thienyl	4-Methyl-thiazol-2-yl	4-Chlor-thiazol-2-y1	4,5-Dimethyl-thiazol-2-yl	4-Phenyl-thiazol-2-yl	2-Methoxy-thiazol-5-yl	4-Methyl-2-pyridyl	6-(2-Methoxyethy1)-2-pyridy1	6-Methylthio-2-pyridyl	6-Methoxy-3-pyridy1	6-Methoxy-2-pyridyl	6-Methyl-2-pyridyl	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-2-pyridyl	6-(2,2,2-Trifluor-ethoxy)-3-pyridyl	5-Pyrimidiny1	6-Dimethylamino-3-pyridyl	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	3-Ethoxycarbony1-1-methy1-pyrazo1-5-y1	2-Methylthio-pyrimidin-5-yl	2-Pyrimidinyl	2-Methylthio-pyrimidin-4-yl
X	H	Н	H	H	H	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н
J.	SO ₂ СН ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	s0 ₂ сн,											
R5	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	H
R4	СН3	СНЭ	CH ₃	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	CH ₃						
R ³	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	CH3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3	СН3						
Nr.	1.1012	1.1013	1.1014	1.1015	1.1016	1.1017	1.1018	1.1019	1.1020	1.1021	1.1022	1.1023	1.1024	1.1025	1.1026	1.1027	1.1028	1.1029	1.1030	1.1031	1.1032

	63	24	25		×	7
		i E	: =	SO ₂ CH ₃	н	5-Methylthio-1,3,4-thiadiazol-2-yl
	_		=	SO2CH3	Н	5-Methoxy-1,3,4-thiadiazol-2-yl
Т	\top	<u> </u>	: =	SO,CH,	H	4,5-Dihydro-thiazol-2-yl
1.1035	\top	î E	: =	SO,CH,	H	5-Methyl-oxazol-2-yl
\neg	$\neg \neg$	£ 5	: #	SO,CH3	H	5-Phenyl-oxazol-2-yl
	\top	E E	=	SO,CH,	H	2-Methyl-oxazol-5-yl
T	十	<u> </u>	=	SO,CH,	H	2-Phenyl-oxazol-5-yl
\neg	丁			so.ch.	Ξ	2-Methyl-1,3,4-oxa-diazol-5-yl
1.1040		5		30,200	5	2-Pheny1-1, 3, 4-oxa-diazol-5-y1
1.1041	CH ₃	CH3	E	SU ₂ CH ₃		r m_: £1::0_mothy1_1 2 4_0xadiaz01-3-v1
1.1042	CH3	CH ₃	H	SO ₂ CH ₃	H	5-IIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIIII
1 1043	CH3	GH.	E	SO ₂ CH ₃	н	5-Methy1-1, 2, 4-oxadiazol-3-yı
700	i i	£	=	S0,CH3	н	5-Pheny1-1, 2, 4-oxadiazol-3-yl
1044			<u> </u>	RO-CH.	H	5-Phenyl-isoxazol-3-yl
1.1045	EH.3	5		5020113	12	1-(4-Chlorphenyl)-1,2,4-triazol-2-yl
.1046	CH3	CH3	Ξ	SO2CH3		C 0 K-d1-hvdro-is0xazol-3-v1
1.1047	CH3	CH ₃	Ξ	SO ₂ CH ₃	II.	Cyano - 4, 7 or my and company of the company of th
1,1048	GH,	£	三	SO ₂ CH ₃	Н	5,6-Dihydro-4H-1,3-tn1azın-z-yı
1049	É	ŧ	ַ≡	SO ₂ CH ₃	н	1,3-Dithiolan-2-yl
201	1	Ę	1=	SO,CH,	Н	1,3-Dioxolan-2yl
1.1050			: :	יוט כמי	7	1,3-Dithian-2-yl
1.1051	CH ₃	$\tilde{\Xi}$	=	2020113		1 3-nioxan-2-v1
1.1052	CH ₃	GH ³	Œ	SO ₂ CH ₃	H.	
1 1053	Ű	E	三	SO ₂ CH ₃	Н	1,3-0xath10lan-2-y1
			1			

	_		_				,			_	73	<u>, </u>									
2	1,2,4-Triazol-1yl	3-Methyl-1,2,4-thiadiazol-5-yl	1,2,4-Thiadiazol-5-yl	Thiazolin-4,5-dion-2-yl	3-0xo-3-H-1, 2, 4-di-thiazol-5-yl	2-0xo-2-H-1,3,4-dithiazol-5-y1	2-Thienyl	3-Thienyl	2-Furyl	3-Furyl	3-Methyl-isoxazol-5-yl	5-Thiazoly1	4-Thiazoly1	2-Thiazolyl	3-Isoxazolyl	2-Pyridyl	3-Pyridy1	4-Pyridyl	2-Benzthiazolyl	2-Chinolinyl	4-Methyl-oxazol-2-yl
Σ	Н	н	н	Н	H	н	Cl	Cl	c1	C1	13		CI	C 1	C1	c1	C1	C 1	cı	c1	c1
Ţ	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ СН ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	CF_3	CF_3	CF_3	CF_3	CF_3	CF_3	CF_3	CF_3	CF_3	CF_3	CF_3	CF_3	CF_3	CF_3	CF3
R5	н	н	н	H	н	Н	Н	н	Н	н	н	н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	Н	Н
R4	СН3	CH3	СН3	СН3	CH ₃	СН	H	н	Н	Н	Н	н	н	Н	Н	н	н	н	н	Н	Н
R ³	CH ₃	СН3	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH,	H	н	Н	Н	H	н	H	н	н	н	H	н	Ħ	Ħ	π
Nr.	1.1054	1.1055	1.1056	1.1057	1.1058	1.1059	1.1060	1.1061	1.1062	1.1063	1.1064	1.1065	1.1066	1.1067	1.1068	1.1069	1.1070	1.1071	1.1072	1.1073	1.1074

		3 1	7
		C1	5-Pyrimidinyi
,		C1	2-Thienyl
		C1	3-Thienyl
		C1	2-Furyl
		C1	3-Furyl
		C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
		<u>1</u>	5-Thiazolyl
		C1	4-Thiazolyl
		12	2-Thiazoly1
		15 15	3-Isoxazolyl
CJ	S		2-Pyridyl
Cl	S		3-Pyridyl
CJ	S	1	4-Pyridyl
CI	O		2-Benzthiazolyl
C1	S		2-Chinolinyl
13	S		4-Methyl-oxazol-2-yl
		2	5-Pyrimidinyl
		2	2-Thienyl
		2	3-Thienyl
		C1	2-Fury1
		C1	3-Furyl

Nr.	R ³	R4	R5	1	Σ	7
1.1096	н	н	H	OCF3	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1097	н	н	н	OCF3	C1	5-Thiazolyl
1.1098	н	Н	Ξ	OCF3	C1	4-Thiazolyl
1.1099	Н	Ξ	Ξ	OCF3	C1	2-Thiazolyl
1.1100	H	H	ェ	OCF3	C1	3-Isoxazoly1
1.1101	H	Ħ	Ξ	OCF3	C1	2-Pyridyl
1.1102	н	Н	Ξ	OCF3	C1	3-Pyridy1
1.1103	Н	н	н	OCF3	C1	4-Pyridyl
1.1104	æ	Н	н	OCF3	C1	2-Benzthiazolyl
1.1105	н	Ξ	н	OCF3	C1	2-Chinolinyl
1.1106	н	н	н	OCF3	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1107	н	н	Н	OCF3	C1	5-Pyrimidinyl
1.1108	Н	Н	н	SO ₂ NHCH ₃	C1	2-Thienyl
1.1109	н	Н	Н	SO ₂ NHCH ₃	C 1	3-Thienyl
1.1110	н	н	Н	SO ₂ NHCH ₃	C1	2-Furyl
1.1111	Н	н	н	SO ₂ NHCH ₃	C1	3-Furyl
1.1112	H	н	н	SO ₂ NHCH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1113	Н	н	н	SO ₂ NHCH ₃	C1	5-Thiazolyl
1.1114	H	Ŧ	Œ	SO ₂ NHCH ₃	C1	4-Thiazolyl
1.1115	Н	Ξ	H	SO ₂ NHCH ₃	C1	2-Thiazolyl
1.1116	Н	н	Ή	SO ₂ NHCH ₃	C1	3-Isoxazoly1

	63	40	Şã	-	Σ	2
NI.	4 H	4 7	Ξ Ξ	SO,NHCH,	C1	2-Pyridyl
11118	: =	: =	=	SO ₂ NHCH ₃	c1	3-Pyridyl
1 1119	: =	=	E	SO ₂ NHCH ₃	C1	4-Pyridyl
1.1120	E	E	H	SO ₂ NHCH ₃	c1	2-Benzthiazolyl
1.1121	E	王	표	SO ₂ NHCH ₃	C1	2-Chinolinyl
1.1122	×	三	Ξ	SO ₂ NHCH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1123	三	Ξ	Œ	SO ₂ NHCH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
1.1124	=	Ξ	三	NHSO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
1.1125	 =	Ξ	Ξ	NHSO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
1 1126	=	三	Ξ	NHSO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
1 1127	=	=	三	NHSO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
1128	=	=	=	NHSO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1179	=	=	=	NHSO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazoly1
1130	: =		=	NHSO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
1131	=	=	=	NHSO ₂ CH ₃	C]	2-Thiazolyl
1,1132		≡	E	NHSO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazoly1
1,1133	=	 =	=	NHSO ₂ CH ₃	c1	2-Pyridyl
1 1134	=	=	Ξ	NHSO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
1 1135	=	1=	 =	NHSO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
1.1136	Ξ	=	Ξ	NHSO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
1,1137	=	Ξ	=	NHSO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl

Nr.	R³	R4	RS	L	Σ	7
1.1138	н	æ	E	NHSO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1139	н	Н	Ξ	NHSO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidiny1
1.1140	Н	н	E	OSO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
1.1141	н	н	н	0SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
1.1142	Н	Н	н	OSO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
1.1143	Н	Н	н	OSO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
1.1144	Н	Н	Н	OSO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1145	Н	Н	Н	OSO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazoly1
1.1146	н	Н	Н	OSO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
1.1147	Н	Н	Н	OSO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
1.1148	Н	ĸ	Н	OSO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazoly1
1.1149	Н	H	Н	OSO ₂ CH ₃	Cl	2-Pyridy1
1.1150	Н	н	Н	0502СН3	Cl	3-Pyridy1
1.1151	Н	н	Н	OSO ₂ CH ₃	ເລ	4-Pyridyl
1.1152	Н	н	Н	OSO ₂ CH ₃	Cl	2-Benzthiazolyl
1.1153	Н	H	Н	OSO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
1.1154	Н	н	Н	OSO ₂ CH ₃	Cl	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1155	Н	н	Н	OSO ₂ CH ₃	Cl	5-Pyrimidinyl
1.1156	Н	н	Н	ососн	C1	2-Thienyl
1.1157	Н	н	Н	ососн	CI	3-Thienyl
1.1158	Н	н	Н	ососн	C1	2-Furyl

	T	Т	丁		_	Т	Т	7	_		Γ	Т	T	78 		Γ	T	\neg		Γ	Τ	T	1	_	T	Т	\neg	
c	7,	3-Furyl	3-Methy1-isoxazol-5-yl	5-mhiazolvl	A This is a line of the late o	4-1111020171	2-Thiazoly1	3-Isoxazolyl	2-Puridul	2 Direction	3-Fyriage	4-Pyridyi	2-Benzthiazolyl	2-Chinolinyl	1-Wethyl-oxazol-2-yl		5-Pyrimidiny1	2-Thienyl	1-mhionv1		2-Fury1	3-Furyl	3-Methyl-isoxazol-5-yl	T B1.500.33	5-Intacory.	4-Thiazolyl	2-Thiazolyl	
	æ	C1	C1		13	c1	Cl	[13 6		C1	c1	C1	10		C1	<u>C1</u>	ch.	00113	ОСН3	осн3	осн3	OCH.	oen 3	ОСН	OCH ₃	OCH,	100
	1	ососн				ососн ₃	OCOCH	50000	ОСОСИЗ	ососн	ососн3	0СОСН3	OCOCH,	0000	ососн	ососн3	OCOCH	20000	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO,CH,	(m.700	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SOCH	20 000	SO2CH3
	R ⁵ I		1) Н	H		1	<u></u>	H	I	E			Ξ	Ŧ	:		H	H	Ξ	٦		Ξ	×]_		王
	R4 R	12	1	E	Ξ.	H	T	1	<u>=</u>	×	H	=	1	- T	Ξ	н		<u> </u>	Ŧ.	н	×]:	=	王	I	1.	=	工
	1 F2	1		Ξ.	H	=	1	<u> </u>	H	н	E	=		Ξ	I	Ξ		Ξ	H	Œ	=	<u> </u>	=	×]=	<u> </u>	=	H
	2		一	1160	1.1161	1 1162	7	1.1163	1.1164	1.1165	1,1166	1 1167	1.110	1.1168	1.1169	1 1170		1.1171	1.1172	1.1173	1 1174		1.1175	1.1176	1177		1.1178	1,1179

	Τ	Τ	Т	Τ	T	Т	Τ	Т	T	Τ	79 T	T	Т	T	T	Т	Т	Т	Т	T	Т
2	3-Isoxazoly1	2-Pyridyl	3-Pyridy1	4-Pyridyl	2-Benzthiazolyl	2-Chinolinyl	4-Methyl-oxazol-2-yl	5-Pyrimidinyl	2-Thienyl	3-Thienyl	2-Furyl	3-Furyl	3-Methyl-isoxazol-5-yl	5-Thiazolyl	4-Thiazolyl	2-Thiazolyl	3-Isoxazolyl	2-Pyridy1	3-Pyridyl	4-Pyridyl	2-Benzthiazolyl
Σ	осн	осн	осн	осн	осн	осн3	оснз	осн	CF3	CF3	CF3	CF_3	CF3	CF3	CF_3	CF_3	CF_3	CF3	CF_3	CF_3	CF_3
Ţ	SO ₂ CH ₃																				
R5	Н	Н	Ħ	H	Н	н	Н	Н	Н	Н	н	Н	Н	н	Н	Н	н	н	н	н	н
R4	Н	Н	н	H	H	Н	Н	Н	Н	Н	н	н	Н	н	Н	н	н	Н	н	Н	Н
R3	Н	H	н	Ξ	Ξ	н	Н	Н	н	Н	н	н	Н	Н	Н	н	н	æ	н	三	H
Nr.	1.1180	1.1181	1.1182	1.1183	1.1184	1.1185	1.1186	1.1187	1.1188	1.1189	1.1190	1.1191	1.1192	1.1193	1.1194	1.1195	1.1196	1.1197	1.1198	1.1199	1.1200

			_	_			-				Τ-	_	0		_	_	_	_		Т	T		-	Г	Τ	7	
7	2-Chinolinyl	4-Methyl-oxazol-2-yl	5-Pvrimidinyl	0_Ehionul	2 - III eily 1	3-Thienyl	2-Furyl	3-Furyl	3-Methyl-isoxazol-5-yl	5-Thiazolv1		4-Thiazolyı	2-Thiazolyl	3-Isoxazoly1	5	2-ry11dy1	3-Pyridyl	4-Pyridyl	2-Benzthiazolyl		Z-Cninolinyi	4-Methyl-oxazol-2-yl	5-Pyrimidinyl	5 ET. (64.;]	runeny.	3-Thienyl	
Σ	CF3	CF3	, E.	7	C1	C1	C1	C1	C1	[]	15	C1	C1			[]	C1	C.1	5	7.7	C1	C1	5		C)	C1	
1	0,СН,				SOCH ₃	SOCH ₃	SOCH ₃	SOCH	SOCH	5	SOCH ₃	SOCH ₃	SOCH	(maga	SUCH ₃	SOCH ₃	SOCH	gova.	300113	SOCH ₃	SOCH ₃	SOCH	aoca.	ouch3	SCH ₃	SCH ₃	
28					E	H	E	=	: =	=	Н	F] ::		H	H]=	:	_	Œ.	H]=		=	王	프	
24	\top			<u></u>	н	E	-	: 5	: :		=	Ξ]:		H	Н],		Į.	×	Œ] =		H	н	=	
63		1		H	H	I	7	: =		=	Ξ.	Ξ		<u>=</u>	Ξ	H			E	Ξ	=			Ξ	王	=	:
	NE.		寸	1.1203	1.1204	1		十	1.1207	1.1208	1.1209	1 1210		1.1211	1.1212	1.1213		1.1214	1.1215	1.1216	1 1217		1.1218	1.1219	1.1220	1 1221	1.1661

										,	91				· 1						
2	2-Furyl	3-Furyl	3-Methyl-isoxazol-5-yl	5-Thiazolyl	4-Thiazolyl	2-Thiazolyl	3-Isoxazoly1	2-Pyridyl	3-Pyridyl	4-Pyridyl	2-Benzthiazolyl	2-Chinolinyl	4-Methyl-oxazol-2-yl	5-Pyrimidinyl	2-Thienyl	3-Thienyl	2-Furyl	3-Furyl	3-Methyl-isoxazol-5-yl	5-Thiazolyl	4-Thiazolyl
M	C1	Cl	C1	Cl	C1	C1	c1	Cl	c1	C1	Cl	C1	C1	Cl	C 1	C1	C1	C1	C1	C1	C1
L	SCH ₃	SCH ₃	SCH ₃	SCH ₃	SCH ₃	SCH ₃	S СН ₃	SCH3	SCH3	SCH ₃	SCH ₃	SCH ₃	SCH ₃	SCH ₃	SO ₂ C ₂ H ₅						
R ⁵	н	н	н	H	H	Ŧ	н	H	H	Ξ	三	æ	표	Ξ	Ξ	H	Ξ	王	ж	Ξ	Ξ
R4	H	H	н	E	H	H	H	Ξ	Ξ	王	Ξ	ェ	田田	Ξ	三	Ξ	E	Ξ	Ξ	Ξ	Ή
В3	H	王	H	H	H	三	Ξ	Ξ	=	æ	Ξ	=	ェ	罡	三	프	三	=	E	ェ	н
Nr.	1.1222	1.1223	1.1224	1.1225	1.1226	1.1227	1.1228	1.1229	1.1230	1.1231	1.1232	1.1233	1.1234	1.1235	1.1236	1.1237	1.1238	1.1239	1.1240	1.1241	1.1242

Nr	R3	R4	<u>8</u> 2	L	×	2
1 1243	Ħ	2	H	SO ₂ C ₂ H ₅	C]	2-Thiazolyl
1 1244	=	æ	Œ	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	3-Isoxazoly1
1 1245	:]=	1	ı	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Pyridyl
C # 9 1 . 1	: :		: :	-H-7-08	[2]	3-Pyridyl
1.1246	E	E	=	30252115		A_Duridul
1.1247	Æ	H	Н	SO ₂ C ₂ H ₅	CI	1 to
1.1248	H	×	н	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Benztniazolyı
1.1249	Ξ	ェ	н	SO ₂ C ₂ H ₅	C1	2-Chinolinyl
1.1250	H	Ξ	н	SO ₂ C ₂ H ₅	c1	4-Methyl-oxazol-2-yl
1.1251	H	噩	표	SO ₂ C ₂ H ₅	c1	5-Pyrimidinyl
1.1252	E	Ξ	三	C1	SO ₂ CH ₃	2-Thienyl
1 1253]=	=	三	C1	SO ₂ CH ₃	3-Thienyl
1 1254		=	=	<u>C1</u>	SO ₂ CH ₃	2-Furyl
1.1673	<u> </u>	-	=	C1	SO ₂ CH ₃	3-Furyl
1.1233		<u>. </u>	<u> </u>	5	SO,CH,	3-Methyl-isoxazol-5-yl
1.1256	=	=		10 10	SO-CH-	5-mbiazolvl
1.1257	Ξ	=	=	5	302cm3	1 - Et i 200 V
1.1258	Œ	н	Ξ	C]	SO ₂ CH ₃	4-1111460171
1.1259	Ξ	H	H	c1	SO ₂ CH ₃	2-Thiazolyi
1.1260	三	ェ	Ħ	C]	SO ₂ CH ₃	3-Isoxazolyl
1.1261	Ξ	三	三	C1	SO ₂ CH ₃	2-Pyridyl
1.1262	E	프	=	C1	SO ₂ CH ₃	3-Pyridy1
1 1263	=	=	프	C1	SO ₂ CH ₃	4-Pyridyl

Γ		Π	Π	Τ	Γ	Π	T -	Γ			83				Γ			Π			Γ
	2-Benzthiazolyl	2-Chinoliny1	4-Methyl-oxazol-2-yl	5-Pyrimidinyl	2-Thienyl	3-Thienyl	2-Furyl	3-Furyl	3-Methyl-isoxazol-5-yl	S-Thiazolyl	4-Thiazolyl	2-Thiazolyl	3-Isoxazolyl	2.Pyridyl	3-Pyridyl	4-Pyridyl	2-Benzthiazolyl	2-Chinolinyl	4-Methyl-oxazol-2-yl	5-Pyrimidinyl	5-0xazoly1
Z	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃ 2	SO ₂ CH ₃ 4	502СН3	C1 2	C1 3	c1 2	C1 3	C1 3	c1 5	C1 4	c1 2	C1 3	C1 2	C1 3	C1 4	c1 2	c1 2	C1 4	cı 5	C1 5
ı	c1	C1	C1	C1	SO ₂ C ₂ H ₅	SO,CH,															
R5	E	H	H	H	H	н	Н	H	Н	н	н	н	H	н	н	Н	Н	Н	Н	H	Ħ
R4	=	H	Ξ	H	GH ₃	GH.)	GH.)	CH,	GH3	CH3	CH3	CH ₃	CH3	CH3	CH ₃	CH ₃	CH3	CH3	CH ₃	CH ₃	F
R3	H	E	Ξ.	<u>_</u>	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH3	CH ₃	CH ₃	CH3	CH ₃	CH3	СН3	CH ₃	CH3	7				
Nr.	1.1264	1.1265	1.1266	1.1267	1.1268	1.1269	1.1270	1.1271	1.1272	1.1273	1.1274	1.1275	1.1276	1.1277	1.1278	1.1279	1.1280	1.1281	1.1282	1.1283	1.1284

Nr.	К 3	R4	R5	7	¥	2
1.1285	GH _J	H	Ξ	SO ₂ CH ₃	C 1	5-0xazoly1
1.1286 CH ₃ CH ₃	CH ₃	CH3	王	SO ₂ CH ₃	C1	5-0xazoly1

Tabelle 2: Verbindungen der Struktur Ie

R1 OH O	R2 C C C C C C C C C C C C C C C C C C C	

_	_	_	85	, T	т	_	_	1	1	, 	T	1	т-
2	2-Thienyl	3-Thienyl	2-Furyl	3-Furyl	3-Methyl-isoxazol-5-yl	5-Thiazoly1	4-Thiazolyl	2-Thiazolyl	3-Isoxazoly1	2-Pyridyl	3-Pyridyl	4-Pyridyl	2-Benzthiazolyl
Æ	C1	C1	ເລ	C1	C1	ເລ	C1	C1	ເມ	C1	C1	C1	C1
ч	SO ₂ CH ₃	s0 ₂ сн ₃	so ₂ сн ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃	SO ₂ CH ₃						
R5	Н	Н	Н	Н	Н	н	н	н	н	Н	Н	Н	Н
R ²	снэ	cH _J	СН3	СН3	снэ	СН3	снэ	снэ	СН3	снэ	снз	снэ	СН3
R1	СН	СН	СН3	СН3	СН3	СН3							
Nr.	2.1	2.2	2.3	2.4	2.5	2.6	2.7	2.8	2.9	2.10	2.11	2.12	2.13

71.	pl	R2	R5	J	М	2
. -	CH	CH3	Н	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
2 15	CH.	CH3	н	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
2.13	CH	CH.	H	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
2.10	Girls	CH.	Br	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
4.17	CH3	Çii.3	Br	S0 ₂ CH ₃	C]	3-Thienyl
2.18	CH3	Citis		SO-CH,	C1	2-Furyl
2.19	СН3	СН3	BI	3020113	5	3-200
2.20	СН3	СН3	Br	SO ₂ CH ₃	3 6	Lynd - Consum - Control - C
2.21	CH ₃	СН3	Br	SO ₂ CH ₃	5	3-mechy1-1sovazo1-3-y1
2.22	CH3	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazoly1
2 23	CH	CH3	Br	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
2.2.2	Cus	CB.	Br	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
67.7	Cn3	Cin's	Br	SO ₂ CH ₃	CI	3-Isoxazolyl
2.25	CH3	21.3	Br	SO,CH,	C1	2-Pyridyl
2.26	CH ₃	CH3		מט עם	[5]	3-Pvridyl
2.27	CH ₃	CH ₃	Br	302Cn3		1 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2 2
2 28	CH3	CH ₃	Br	SO ₂ CH ₃	CI	4 - Fyr 10y 1
2000	ÇH,	CH3	Br	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
69.7	Cu.	CH3	Br	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
2.30	Çin3	5 2	Br	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
2.31	CH ₃	Cn3	1	CO-CH,	C1	5-Pyrimidinyl
2.32	CH ₃	CH ₃	BI	3020113	5	2-8710011
2.33	CH3	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	15	z-intenyi
2 2	CH3	CH3	Cl	SO ₂ CH ₃	Cl	3-Thienyl
6:33						

Nr.	R¹	R ²	R5	L	×	2
2.35	СН3	CH ₃	C1	SO ₂ CH ₃	C]	2-Furyl
2.36	СН3	СН3	C1	SO ₂ CH ₃	C1	3-Fury1
2.37	СН3	СН3	c1	SO ₂ CH ₃	Cl	3-Methyl-isoxazol-5-yl
2.38	СН3	СН3	C1	SO ₂ CH ₃	Cl	5-Thiazoly1
2.39	СН3	СН3	Cl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
2.40	снз	СН3	C1	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
2.41	СН3	СН3	C1	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazoly1
2.42	СН3	СН3	C1	SO ₂ CH ₃	ເລ	2-Pyridyl
2.43	СН3	СН3	cı	SO ₂ CH ₃	Cl	3-Pyridyl
2.44	СН3	СН3	C1	SO ₂ CH ₃	Cl	4-Pyridyl
2.45	СН3	СН3	C1	SO ₂ CH ₃	Cl	2-Benzthiazolyl
2.46	СН3	CH ₃	Cl	SO ₂ CH ₃	Cl	2-Chinolinyl
2.47	СН3	CH ₃	c1	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
2.48	СН3	СН3	C1	SO ₂ CH ₃	c1	5-Pyrimidinyl

Tabelle 3: Verbindungen der Struktur If

27	
Σ	
$\circ = \langle$	
₩_{	\sum
нс	

1	-	Σ	2
. IV	יויים מיים	C1	2-Thienyl
3.1	3025413		2-41
3.2	SO ₂ CH ₃	C1	
3.3	SO ₂ CH ₃	c1	2-Furyı
3.4	SO ₂ CH ₃	C1	3-Fury1
	SO,CH,	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
	10 00	[2	5-Thiazoly1
3.6	SU2CH3	5	4-mh; 220]V]
3.7	SO ₂ CH ₃	C1	4-111142013
	SO-CH.	<u>C1</u>	2-Thiazoly1
3.8	3020113		2_Teoxes201v1
3.9	SO ₂ CH ₃	C1	
	go,CH,	13	2-Pyridyl
3.10	20,200		3-Pvridv1
3.11	SO ₂ CH ₃	13	
3 12	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridy1
3.12	SO ₂ CH ₂	15	2-Benzthiazolyl
3.13	5,,,,,,,		2-Chinolinyl
3.14	SO ₂ CH ₃	12	

Nr.	L	M	2
3.15	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
3.16	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidiny1
3.17	SO ₂ CH ₃	СН3	2-Thienyl
3.18	SO ₂ CH ₃	СН3	3-Thienyl
3.19	SO ₂ CH ₃	СН3	2-Furyl
3.20	SO ₂ CH ₃	СН3	3-Fury1
3.21	SO ₂ CH ₃	СН3	3-Methyl-isoxazol-5-yl
3.22	SO ₂ CH ₃	СН3	5-Thiazoly1
3.23	SO ₂ CH ₃	СН3	4-Thiazolyl
3.24	SO ₂ CH ₃	СН3	2-Thiazolyl
3.25	SO ₂ CH ₃	CH ₃	3-Isoxazolyl
3.26	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Pyridyl-
3.27	SO_2CH_3	СН3	3-Pyridyl
3.28	SO ₂ CH ₃	СН3	4-Pyridyl
3.29	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Benzthiazoly1
3.30	SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Chinolinyl
3.31	SO ₂ CH ₃	СН3	4-Methyl-oxazol-2-yl
3.32	SO ₂ CH ₃	СН3	5-Pyrimidinyl

Tabelle 4: Verbindungen der Struktur Ig

Ig

		-	×	2
Nr.	R ²			0-πhienvl
4.1	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	CI	
	n nethlthionronyl	SO,CH,	C1	3-Thienyl
4.2	2-Echyleniopiop1 -		í	2-Euryl
4.3	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	CI	7 1 11 7
	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
4.4	2 - Eculy tent of J	1000		3-Methvl-isoxazol-5-vl
4.5	2-Ethylthiopropyl	SU ₂ CH ₃		
7 ,	2-Ethvlthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazoly1
4.0		15 05	5	4-Thiazolvl
4.7	2-Ethylthiopropy1	SU2CH3		
	2 nthilthiopropy]	SO,CH,	C1	2-Thiazolyl
4.8	2-Eunyiuniopiopi			3-Teoxazolvl
0 4	2-Ethvlthiopropyl	SO ₂ CH ₃	10	* Fromposi C
<u></u>		RO ₂ CH,	C1	2-Pyridyl
4.10	2-Ethylthlopropy.	727		A
11	2-Ethvlthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyr1dy1
1:1		SOCH	C1	4-Pyridyl
4.12	2-Ethylthlopiopy	57.2.2		
61 1	2-Ethvlthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthlazolyı
	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
4.14	Z-Ecnyrunyrunyrun			

Nr.	R ³	1	Σ	2
4.15	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
4.16	2-Ethylthiopropyl	SO ₂ CH ₃	CI	5-Pyrimidinyl
4.17	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	13	2-Thienyl
4.18	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	ເງ	3-Thienyl
4.19	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	ເລ	2-Furyl
4.20	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
4.21	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	Cl	3-Methyl-isoxazol-5-yl
4.22	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	CI	5-Thiazolyl
4.23	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
4.24	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	ເລ	2-Thiazolyl
4.25	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
4.26	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
4.27	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
4.28	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ СН ₃	ເລ	4-Pyridyl
4.29	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl
4.30	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	13	2-Chinolinyl
4.31	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	ເລ	4-Methyl-oxazol-2-yl
4.32	Tetrahydropyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
4.33	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
4.34	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
4.35	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl

Nr. R³ L M Z 4.36 Terrahydropyranyl-4 \$0_2CH³ C1 3-Furyl 4.36 Terrahydropyranyl-4 \$0_2CH³ C1 5-Thiazolyl 4.38 Terrahydropyranyl-4 \$0_2CH³ C1 5-Thiazolyl 4.39 Terrahydropyranyl-4 \$0_2CH³ C1 4-Thiazolyl 4.40 Terrahydropyranyl-4 \$0_2CH³ C1 2-Thiazolyl 4.41 Terrahydropyranyl-4 \$0_2CH³ C1 2-Pyridyl 4.42 Terrahydropyranyl-4 \$0_2CH³ C1 2-Pyridyl 4.43 Terrahydropyranyl-4 \$0_2CH³ C1 2-Pyridyl 4.44 Terrahydropyranyl-4 \$0_2CH³ C1 2-Pyridyl 4.45 Terrahydropyranyl-4 \$0_2CH³ C1 2-Pyridyl 4.46 Terrahydropyranyl-4 \$0_2CH³ C1 2-Pyridyl 4.47 Terrahydropyranyl-3 \$0_2CH³ C1 2-Pyridyl 4.48 Terrahydropyranyl-3 \$0_2CH³ C1					
36 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 3 37 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 4 38 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 4 39 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 2 40 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 2 41 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 2 42 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 2 43 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 2 44 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 2 45 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 2 46 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 2 48 Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1 2 50 Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1 2 51 Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1 2 52 <th></th> <th></th> <th>د.</th> <th>Σ</th> <th>7,</th>			د.	Σ	7,
Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 Tetrahydropyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1 Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃	Nr.	A = [1,100,100,100,100,100,100,100,100,100,1	SOCH	C1	3-Furyl
Tetrahydropyrany1-4	4.36		מט-טמי	12	3-Methyl-isoxazol-5-yl
Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 Tetrahydropyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1 Tetrahydropyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1 Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1	4.37	Tetrahydropyrany1-4	302cm3		5-mh; 2201v1
Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 4 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 2 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 2 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 2 Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 6 Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1 6 Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1 7 Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1 C1 Tetrahydro-thi	4.38	Tetrahydropyrany1-4	SO_2CH_3	CI	-Cintacort
Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 Tetrahydropyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1 Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1	30		SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl	66.	metrahvdropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
.41 Tetrahydropyrany1-4 SO ₂ CH ₃ C1 2 .42 Tetrahydropyrany1-4 SO ₂ CH ₃ C1 4 .43 Tetrahydropyrany1-4 SO ₂ CH ₃ C1 6 .44 Tetrahydropyrany1-4 SO ₂ CH ₃ C1 7 .45 Tetrahydropyrany1-4 SO ₂ CH ₃ C1 7 .46 Tetrahydropyrany1-4 SO ₂ CH ₃ C1 7 .47 Tetrahydropyrany1-4 SO ₂ CH ₃ C1 7 .48 Tetrahydro-thiopyrany1-3 SO ₂ CH ₃ C1 7 4.50 Tetrahydro-thiopyrany1-3 SO ₂ CH ₃ C1 7 4.51 Tetrahydro-thiopyrany1-3 SO ₂ CH ₃ C1 7 4.52 Tetrahydro-thiopyrany1-3 SO ₂ CH ₃ C1 7 4.54 Tetrahydro-thiopyrany1-3 SO ₂ CH ₃ C1 7 4.55 Tetrahydro-thiopyrany1-3 SO ₂ CH ₃ C1 7 4.55 Tetrahydro-thiopyrany1-3 SO ₂ CH ₃ C1 C1 </td <td>06.40</td> <td>1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-</td> <td>SO,CH,</td> <td>C1</td> <td>3-Isoxazolyl</td>	06.40	1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-1-	SO,CH,	C1	3-Isoxazolyl
Tetrahydropyranyl-4 SO2CH3 C1 Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO2CH3	4.41	Tetranydropyrany	20.00		2-Pyridyl
Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1		Tetrahydropyranyl-4	302cn3		2-Duridul
Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1	4.43	Tetrahydropyranyl-4	502СН3	CI	
Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydropyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl	4 44	Tetrahydropyrany1-4	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyr1dy1
Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydropyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl	, , ,	motrabydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	Cl	2-Benzthiazolyl
Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl	4.45	V=[::::::::::::::::::::::::::::::::::::	SOCH	<u>c1</u>	2-Chinolinyl
Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ C1 Tetrahydropyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1 Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1	4.46	Tetrahydropyrdiiy1-4	5	3	4-Methyl-oxazol-2-yl
Tetrahydropyranyl-4 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl	7 4 7	Tetrahydropyranyl-4	SO ₂ CH ₃	כז	
Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl	7	- Lynerymon	SO,CH3	Cl	5-Pyrimidinyl
Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1		Tetranyutopyrany	100	[]	2-Thienyl
Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl	4.49	Tetrahydro-thiopyrany1-3	3020113		J_mb.tonv1
Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl	A 50	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Intent
Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl		metrahydro-thiopyrany1-3	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
Tetranydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl	4.51		SO,CH,	C]	3-Fury1
Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ C1	4.52	Tetrahydro-thropyramyr 3	7.00	5	3-Methyl-isoxazol-5-yl
Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl	4.53	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃		,
Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl Tetrahydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl		metrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazoly1
Tetranydro-thiopyranyl-3 SO ₂ CH ₃ Cl	4.54		SO,CH1	<u>C1</u>	4-Thiazolyl
Tetrahydro-thlopylanyi-3 5223	4.55	Tetranydio-chiopyrung	SO, CH,	C1	2-Thiazolyl
	4.56	Tetrahydro-thlopyrany1-3	3020113		

Nr.	R ³	រ	M	Z
4.57	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	CI	3-Isoxazolyl
4.58	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	נז	2-Pyridyl
4.59	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	כז	3-Pyridyl
4.60	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
4.61	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	10	2-Benzthiazolyl
4.62	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	ເລ	2-Chinolinyl
4.63	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
4.64	Tetrahydro-thiopyranyl-3	SO ₂ CH ₃	CI	5-Pyrimidinyl
4.65	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
4.66	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	Cl	3-Thienyl
4.67	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
4.68	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	c1	3-Furyl
4.69	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
4.70	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	c1	5-Thiazolyl
4.71	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
4.72	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
4.73	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Isoxazolyl
4.74	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	ເລ	2-Pyridyl
4.75	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Pyridyl
4.76	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
4.77	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazolyl

Nr.	R ³	L	¥	2
4.78	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	c1	2-Chinolinyl
4.79	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Methyl-oxazol-2-yl
4.80	1-Methylthio-cyclopropyl	SO ₂ CH ₃	c1	5-Pyrimidinyl
4.81	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thienyl
4.82	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
4.83	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Furyl
4.84	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
4.85	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
4.86	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	C1	5-Thiazolyl
4.87	(Dimethoxy) methy1	SO ₂ CH ₃	C1	4-Thiazolyl
4.88	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
4 89	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	Cl	3-Isoxazolyl
4 90	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
4.91	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	c1	3-Pyridyl
4.92	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	C1	4-Pyridyl
4.93	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	ເງ	2-Benzthiazolyl
4.94	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	C1	2-Chinolinyl
4.95	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	c1	4-Methyl-oxazol-2-yl
4 96	(Dimethoxy) methyl	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
2.75				

Tabelle 5: Verbindungen der Struktur Ih

2/	
E —{	
°=	ہے و
품_/	
\	\prec
	R 4

Ih

Nr.	R ³	R4	\mathbf{r}	W	2
5.1	Н	Н	SO ₂ CH ₃	C1	3-Thienyl
5.2	н	Н	SO ₂ СН ₃	C1	3-Fury1
5.3	Н	Н	SO ₂ CH ₃	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
5.4	Н	н	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
5.5	н	н	SO ₂ CH ₃	C1	2-Pyridyl
5.6	н	Н	SO ₂ СН ₃	C1	3-Pyridy1
5.7	Н	Н	502СН3	C1	4-Pyridyl
5.8	н	Н	SO ₂ CH ₃	C1	2-Benzthiazoly1
5.9	н	Н	SO ₂ CH ₃	C1	5-Pyrimidinyl
5.10	CH ₃	Н	SO ₂ CH ₃	C]	3-Thienyl
5.11	СН3	Н	SO ₂ CH ₃	C1	3-Furyl
5.12	СН3	н	502СН3	C1	3-Methyl-isoxazol-5-yl
5.13	СН3	Н	SO ₂ СН ₃	C1	2-Thiazolyl
5.14	СН3	н	so ₂ сн ₃	ເງ	2-Pyridyl

12	D3	R4	L	×	2
INI .	CH.	- a	SO ₂ CH ₃	c1	3-Pyridyl
5.13	Cu.	= =	SO,CH,	C1	4-Pyridyl
5.10	Cn3		SOCH	C1	2-Benzthiazolyl
5.17	CH3	E .	C		5-Pvrimidinyl
5.18	CH ₃	E	3025113	1	J Hb i carel
5 19	CH1	CH ₃	SO ₂ CH ₃	C1	3-Intenyi
200	CH.	CH1	SO ₂ CH ₃	c1	3-Furyl
3.20	55	,	מט-נים.	[]	3-Methyl-isoxazol-5-yl
5.21	CH ₃	CH3	302003		
7.7	CH.	CH1	SO ₂ CH ₃	C1	2-Thiazolyl
3.22	(1)		מט עם	[]	2-Pvridyl
5.23	CH ₃	CH3	3020113	*	
2 24	CH3	CH3	SO ₂ CH ₃	Cl	3-Pyridyi
1.63	5115	CH.	SO2CH3	C1	4-Pyridyl
5.25	CH3	5,1,3			2-Benzthiazolvl
5.26	CH ₃	CH ₃	SO ₂ CH ₃	C1	
200	Çu.	CH3	SO ₂ CH ₃	Cl	5-Pyrimidinyl
/7.5	Cn3	Ç5			

Die Verbindungen I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich · sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren · als Herbizide. Die I enthaltenden herbiziden 5 Mittel bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schadgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

Unter Berücksichtigung der Vielseitigkeit der Applikationsmethoden können die Verbindungen I bzw. sie enthaltende Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spp. altissima, Beta vulgaris spp. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var.

- 20 napobrassica, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoinensis, Citrus limon, Citrus sinensis Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum,
- 25 (Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spp., Manihot esculenta, Medicago sativa, Musa spp., Nicotiana tabacum
- 30 (N. rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spp., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifo-
- 35 lium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera, Zea mays.

Darüber hinaus können die Verbindungen I auch in Kulturen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die 40 Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

Die Applikation der herbiziden Mittel bzw. der Wirkstoffe kann im Vorauf lauf- oder im Nachauflaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so

45 können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit

WO 96/26200 PCT/EP96/00593

98

nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

- 5 Die Verbindungen I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wäßrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wäßrigen, öligen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granula-
- 10 ten durch versprühen, vernebeln, verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

15

Als inerte Zusatzstoffe kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z. B. Pa-

20 raffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, alkylierte Benzole oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon oder stark polare Lösungsmittel, wie N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

25

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Sub-

- 30 strate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden,
- 35 die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe (Adjuvantien) kommen die Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutylnaphthalinsulfonsäure,

- 40 sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-,
 Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter
 Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether,
 Kondensationsprodukte von sulfoniertem Naphthalin und seiner
 Derivate mit Formaldehyd, Kofldensationsprodukte des Naphthalins
- 45 bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylen- octylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonyl- phenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether,

. ::

Alkylaryl- polyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylen- oxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylenalkylether oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder 5 Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

10

Granulate, z. B. Umhüllungs-, Imprägnierungs~ und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineralerden
wie Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalk15 stein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde,
Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat,
Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder
andere feste Trägerstoffe.

Die Konzentrationen der Wirkstoffe I in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Die Formulierungen enthalten im allgemeinen 0,001 bis 98 Gew. %, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew. %, Wirkstoff. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90 % bis 100 %, vorzugsweise 95 % bis 100 % (nach NMR-Sektrum) eingesetzt.

Die erfindungsgemäßen Verbindungen I können beispielsweise wie 30 folgt formuliert werden:

20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1.1232 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure~N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew. % des Wirkstoffs enthält.

20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 1.1232 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungs- produktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol

PCT/EP96/00593

5

IV

20

25

30

Isooctylphenyl und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew. % des Wirkstoffs enthält.

20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.1232 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew. % des Wirkstoffs enthält.

20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.1232 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin-α-sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser enthält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew. % des Wirkstoffs enthält.

V 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.1232 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew. % des Wirkstoffs enthält.

VI 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 1.1232 werden mit 2 Gewichts- teilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichts- teilen Fettalkoholpolyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile Ölige Dispersion

VII 1 Gewichtsteil der Verbindung Nr. 1.1232 wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

- VIII 1 Gewichtsteil der Verbindung Nr. 1.1232 wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Emulphor EL besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.
- Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die Benzoylderivate I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstums-regulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Bei-
- 10 spielsweise kommen als Mischungspartner Diazine, 4H-3, 1-Benzoxazinderivate, Benzothiadiazinone, 2,6-Dinitroaniline, N-Phenylcarbamate, Thiolcarbamaate, Halogencarbonsäuren, Triazine, Amide, Harnstoffe, Diphenylether, Triazinone, Uracile, Benzofuranderivate, Cyclohexan-1,3-dionderivate, die in 2-Stellung z. B.
- 15 eine Carboxy- oder Carbimino-Gruppe tragen, Chinolincarbonsäurederivate, Imidazolinone, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Aryloxy-, Heteroaryloxyphenoxypropionsäuren sowie deren Salze, Ester und Amide und andere in Betracht.
- 20 Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.
- Die Aufwandmengen an Wirkstoff betragen je nach Bekämpfungsziel, 30 Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0.001 bis 3.0, vorzugsweise 0.01 bis 1.0 kg/ha aktive Substanz (a.S.).

Anwendungsbeispiele

35 Die herbizide Wirkung der Benzoylderivate der Formel I ließ sich durch Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden nach Arten getrennt eingesät.

Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht Die Gefäße wurden leicht beregnet, um Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Test-

WO 96/26200 PCT/EP96/00593

102

pflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung werden die Testpflanzen je
5 nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen werden dafür entweder direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder
sie werden erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige
10 Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt. Die
Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung beträgt 0.125 bzw.
0.0625 kg/ha a.S.

die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 - 25°C 15 bzw. 20 - 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde ausgewertet.

- 20 Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler Wachstumsverlauf.
- 25 Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

	Lateinischer Name	Deutscher Name	Englischer Name
30	Abutiolon theophrasti	Chinesischer Hanf	velvet leaf
	Amaranthus retroflexus	zurückgekrümmter Fuchs- schwanz	redroot pigweed
	Echinochloa crus-galli	Hühnerhirse	barnyardgrass
	Solanum nigrum	Schwarzer Nachtschatten	black nightshade
35	Zea mays	Mais	Indian corn

Selektive herbizide Aktivität bei Nachauflaufanwendung im Gewächshaus

40

BNGDUCIU. ~WU

103

Tabelle 6

5

10

Bsp.-Nr. 1.1232

15	Aufwandmenge (kg/ha a.S.)	0,125	0,0625
13	Testpflanzen	Schädigung in %	
	ZEAMX	10	0
	ABUTH	100	95
	AMARE	100	100
20	ECHCG	98	95
	SOLNI	100	100

Tabelle 7

Herbizide sAktivität bei Nachauflaufanwendung im Gewächshaus

25

30

35	Aufwandmenge (kg/ha a.S.)	0,125	0,0625
	Testpflanzen	Schädigung in %	
	ZEAMX	10	0
	ECHCG	95	95
40	CHEAL	95	95
	SINAL	90	90
	SOLNI	100	100

45

Tabelle 8
Herbizide Aktivität bei Nachauflaufanwendung im Gewächshaus

5

10

	Aufwandmenge (kg/ha a.S.)	0,125	0,0625	
1 6	Testpflanzen	Schädigung in %		
15	ZEAMX	10	0	
	ECHCG	95	95	-
	CHEAL	95	95	

20 Herstellungsbeispiele

A) Herstellung der Ausgangsstoffe

1. 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester

25

30

35

45

a. Zu einer Suspension von 286 g (2.14 mol) Aluminiumtrichlorid in 420 ml 1,2-Dichlorethan wurde bei 15-20°C eine
Lösung von 157 g (2 mol) Acetylchlorid in 420 mol
1,2-Dichlorethan getropft. Anschließend wurde eine Lösung
von 346 g (2 mol) 2-Chlor-6-methylthio-toluol in 1 l
1,2-Dichlorethan zugetropft. Nach 12 Stunden Nachrühren
wurde das Reaktionsgemisch in eine Mischung aus 3 l Eis
und 1 l konz. HCl gegossen. Es wurde mit Methylenchlorid
extrahiert, die organische Phase mit Wasser gewaschen,
mit Natriumsulfat getrocknet und eingeengt. Der Rückstand
wurde im Vakuum destilliert.

Man erhielt 256 g (60 % d.Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methyl-thio-acetophenon,

40 Fp.: 46°C

b. 163 g (0.76 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylthio-acetophenon wurden in 1.51 Eisessig gelöst, mit 18.6 g Natriumwolframat versetzt und unter Kühlung 173.3 g 30 %ige Wasserstoffperoxidlösung zugetropft. Es wurde 2 Tage nachgerührt und anschließend mit Wasser verdünnt. Der

PCT/EP96/00593

5

10

ausgefallene Feststoff wurde abgesaugt, mit Wasser gewaschen und getrocknet.

Man erhielt 164 g (88% d. Th.) 2-Chlor-3-methyl-4-methyl-sulfonyl-acetophenon, Fp.: 110-111°C

- c. 82 g (0.33 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-acetophenon wurden in 700 ml Dioxan gelöst und bei Raumtemperatur mit 1 l einer 12.5 %igen Natriumhypochloritlösung
 versetzt. Anschließend wurde 1 Stunde bei 80°C nachgerührt. Nach dem Abkühlen bildeten sich zwei Phasen, von
 denen die untere mit Wasser verdünnt und schwach angesäuert wurde. Der ausgefallene Feststoff wurde mit Wasser
 nachgewaschen und getrocknet.
- Man erhielt 60 g (73 % d.Th) 2-Chlor-3-methyl-4-methyl-sulfonyl-benzoesäure, Fp.: 230-231°C.
- d. 100 g (0.4 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäure wurden in 1 l Methanol gelöst und bei Rückflußtemperatur 5 Stunden mit HCl begast. Anschließend wird
 eingeengt.
- Man erhielt 88.5 g (84 % d.Th.)

 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester,

 Fp.: 107-108°C
- e. 82 g (0.31 mol) 2-Chlor-3-methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester werden in 21 Tetrachlormethan gelöst und
 unter Belichtung portionsweise mit 56 g (0.31 mol)
 N-Bromsuccinimid versetzt. Das Reaktionsgemisch wurde
 filtriert, das Filtrat eingeengt und der Rückstand in
 200 ml Methyl-tert.-butylether aufgenommem. Die Lösung
 wird mit Petrolether versetzt, der ausgefallene Feststoff
 abgesaugt und getrocknet.

Man erhielt 74.5 g (70 % d.Th) 3-Brommethy1-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester, Fp.: $74-75^{\circ}$ C.

f. Eine Lösung von 41 g (0.12 mol) 3-Brommethyl-2-chlor-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester in 250 ml Acetonitril wurde mit 42,1 g (0.36 mol) N-Methylmorpholin-Noxid versetzt. Der Ansatz wurde 12 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt, anschließend eingeengt und der Rückstand in Essigester aufgenommen. Die Lösung wurde mit WO 96/26200 PCT/EP96/00593

106

Wasser extrahiert, mit Natriumsulfat getrocknet und eingeengt.

Man erhielt 31,2 g (94 % d.Th.) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester, Fp.: 98-105°C

- 2. 2-Chlor-4-methylsulfonyl-3-(trifluormethylsulfonyl)oxy-ben-zoesäure-methylester
- a. 101 g (0.41 mol) 2-Chlor-3-hydroxy-4-methylsulfonyl-ben-zoesäure werden in 1,31 Methanol gelöst und unter Rückfluß 4 Stunden mit HCl begast. Die Lösung wurde eingeengt, der Rückstand mit Dichlormethan aufgenommen und mit K2CO3-Lösung extrahiert. Die wäßrige Phase wurde mit verdünnter Salzsäure auf pH 7 eingestellt und mit Dichlormethan gewaschen. Anschließend wurde auf pH 1 angesäuert und das Produkt mit Dichlormethan extrahiert.
- Man erhielt 76,2 g (71 % d.Th.) 2-Chlor-3-hydroxy-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester.
- b. Eine Lösung aus 76 g (0,29 mol) 2-Chlor-3-hydroxy-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester und 68 g Pyridin in 700 ml Dichlormethan wurde bei -20°C mit 89 g (0.32 mol)
 Trifluormethansulfonsäureanhydrid versetzt. Die Lösung wurde 12 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt, mit Dichlormethan verdünnt und mit Wasser extrahiert. Die organische Phase wurde über Magnesiumsulphat getrocknet und eingeengt.

Man erhielt 94 g (82 % d.Th) 2-Chlor-4-methyl-sulfonyl-3-(trifluormethylsulfonyl)oxy-benzoesäure-methylester, Fp.: 69°C.

- 35 B) Herstellung der Zwischenprodukte
 - 1. 3-(3-Isopropylisoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure-methylester
- a. 30 g (102 mmol) 3-Brom-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester, 90 mg Palladiumdichlorid und 240 mg Triphenylphosphin in 200 ml Diethylamin und 60 ml Dimethylformamid werden mit 10 g (102 mmol) (Trimethylsilyl)-acetylen und 180 mg Kupfer-I-jodid versetzt und 4,5 Stunden bei 40°C gerührt. Anschließend wurde noch 12 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt. Das Reaktionsgemisch wurde

10

filtriert, das Filtrat eingeengt und der Rückstand über Kieselgel mit Toluol als Laufmittel chromatographiert.

Man erhielt 17,3g (55% d.Th.) 4-Methylsulfonyl-3-(trimethylsilyl)ethinyl-benzoesäuremethylester als Öl.

- b. 25 g 4-Methylsulfonyl-3-(trimethylsilyl)ethinyl-benzoesäuremethylester werden mit 100 ml Methanol und 0,9 g Kaliumkarbonat 18 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wurde vom Feststoff abgesaugt, eingeengt und mit Essigester/Wasser extrahiert. Die organische Phase wurde über Natriumsulfat getrocknet und eingeengt.
- Man erhielt 15 g (79 % d.Th.) 4-Methylsulfonyl-3-ethinylbenzoesäure-methylester, Fp.: 95-98°C.
- c. 13,5 g (57 mmol) 4-Methylsulfonyl-3-ethinyl-benzoesäuremethylester werden in 50 ml Dichlormethan gelöst, mit
 5,2g (60 mmol) Isobutyraldehydoxim versetzt und 41 g
 einer 12,5 %igen Natriumhypochloritlösung zugetropft.
 Anschließend wurde 24 Stunden bei Raumtemperatur nachgerührt. Der Reaktionsansatz wurde anschließend mit
 Dichlormethan/Wasser extrahiert, die organische Phase
 eingeengt und der Rückstand über Kieselgel mit Toluol/
 Essigester als Laufmittel chromatographiert.

Man erhielt 8.8 g (48 % d.Th) 3-(3-Isopropyl-isoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester, Fp.: 102-104°C.

- 2-Chlor-3-(isoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester
- a. 15 g (54 mmol) 2-Chlor-3-formyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester (Beisp. A.1.) und 4,2 g (60 mmol)
 Hydroxylaminhydrochlorid werden mit 300 ml Methanol gerührt und eine Lösung von 3,18 g (30 mmol) Natriumcarbonat in 80 ml Wasser zugetropft. Die Reaktionsmischung wird über Nacht bei Raumtemperatur gerührt, anschließend wird das Methanol abdestilliert und der Ansatz
 mit Ether/Wasser extrahiert. Die Etherphase wird mit Natriumsulfat getrocknet und eingeengt.
- Man erhält 14,4 g (91% d.Th.) 2-Chlor-3-hydroxyimino-45 methyl-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester, Fp.: 126-128 °C.

35

108

b. 5,3 g (18 mmol) 2-Chlor-3-hydroxyiminomethyl-4-methyl-sulfonyl-benzoesäuremethylester werden in 50 ml Dichlormethan gelöst und bei 0-5°C 30 Minuten lang Acetylen eingeleitet. Anschließend wird mit mit einer Spatelspitze Natriumacetat versetzt und 15ml einer 10%igen Natriumhypochlorit-Lösung bei 10°C unter weiterer Acetylen-Einleitung zutropft. Nach beendeter Zugabe wird für weitere 15 Minuten Acetylen bei 10°C eingeleitet und anschließend 12 Stunden nachgerührt. Danach werden die Phasen getrennt, die organische Phase mit Wasser gewaschen, mit Natriumsulfat getrocknet und eingeengt.

Man erhält 4,8 g (84 % d.Th.) 2-Chlor-3-(isoxazol-3-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure-methylester, Fp.: 145-147°C.

- 3. 2-Chlor-3-(thiazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester
- 33 g (88 mmol) 2-(Tributylstannyl)-thiazol, 17,5 g (44 mmol)
 2-Chlor-4-methylsulfonyl-3-(trifluormethylsulfonyl)oxy-benzoesäure-methylester (Beisp. A.2.), 5,8 g Lithiumchlorid, 1 g
 Tetrakis-(triphenylphosphin)-palladium-(0), eine Spatelspitze
 2,6-Di-tert.-butyl-4-methyl-phenol und 200 ml 1,4-Dioxan werden in einem Autoklaven 3 Stunden bei 140°C unter Eigendruck
 gerührt. Nach dem Abkühlen wird die Reaktionsmischung über
 eine Kieselgelschicht abfiltriert, mit Methyl-tert.-butylether nachgewaschen und eingeengt. Der Rückstand wird über
 Kieselgel mit Toluol/Essigester als Laufmittel chromatographiert.

Man erhält 9,1 g (62,6% d.Th.) 2-Chlor-3-(thiazol-2-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester, Fp.: 135-138°C.

4. 2-Chlor-3-(oxazol-5-yl)-4-methylsulfonylbenzoesäuremethylester

remethylester (Beispiel A.1), 17,6 g (0,09 mol) Tosylmethylenisocyanid und 6,2 g (0,045 mol) fein gepulvertes Kaliumkarbonat werden mit 450 ml Methanol 5 Stunden bei Rückflußtemperatur gerührt. Anschließend wird das Lösungsmittel abgezogen, der Rückstand in Essigester aufgenommen und mit Wasser extrahiert. Die Essigesterphase wird mit Natriumsulfat getrocknet und eingeengt.

Man erhält 24,7 g (87 % d.Th.) 2-Chlor-3-(oxazol-5-yl)-4-methylsulfon-benzoesäuremethylester, 1H -NMR (CDCl $_3$)

δ: 8,24 (d, 1H), 8,15 (s, 1H), 8,01 (d, 1H), 7,40 (s,1H), 4,0 5 (s, 3H), 2,96 (s, 3H)

In analoger Weise werden die in der nachfolgenden Tabelle aufgeführten Zwischenprodukte erhalten:

10 Tabelle 9

T Z

IIIa

	Nr.	Т	L	М	Z	Phys. Daten FP [°C]
20	9.1	Methoxy	-SO ₂ Me	Cl	3-Furyl	1H-NMR(CDCl ₃) \delta : 8,24 (d,1H),7,82 (d,1H), 7,64 (m,2H),6,55 (s,1H) 3,99 (s,3H),2,80 (s,3H)
	9.2	Methoxy	-SO₂Me	Н	2-Thiazolyl	95 - 98
25	9.3	Ethoxy	-SO ₂ Et	C1	2-Thiazolyl	1H-NMR (CDC1 ₃) δ: 9,18 (d,1H),7,97 (m,2H), 7,71 (d,1H)),4,47 (q,2H) 3,36 (q,2H),1,42 (t,3H), 1,24 (t,3H)
30	9.4	ОН	-SO ₂ CH ₃	Cl	2-Thiazolyl	288-290
	9.5	ОН	-SO ₂ CH ₃	C1	2.Thienyl	177-180
	9.6	ОН	-SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Thienyl	175-178
	9.7	ОН	-SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Furyl	167-171
35	9.8	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Thienyl	91-95
33	9.9	ОН	-SO ₂ CH ₃	Н	2-Furyl	219-223
	9.10	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	CH ₃	2-Furyl	103-106
	9'.11	ОН	-SO ₂ CH ₃	Н	2-Thienyl	222-224
40	9.12	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	Cl	3.Isoxazoly	1H-NMR (CDCl ₃) δ: 8,62 (1H); 8,18 (1H); 6,58 (1H); 3,98 (3H); 3,22 (3H)
	9.13	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	Cl	5-Phenyl- oxazol-2-yl	115-118
45	9.14	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	C1	5-Oxazolyl	-H-NMR (CDCl ₃) δ: 8,76 (1H); 8,22 (1H); 8,10 (1H); 7,63 (1H); 4,04 (3H); 3,08 (3H)

110

1					5 0 3	Live amen (cmc) a S
	9.15	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	C1	5-Cyclopro- pyl-isoxa-	¹ H-NMR (CDCl ₃) δ: 8,20 (1H);
					zolyl	7,95 (1H); 6,12 (1H);
		:			,	3,98 (3H); 3,22 (3H);
5						2,15 (1H); 1,03-1,09 (4H)
	0.16	34 - 1- 1	CO C''	Cl	4,5-Dihy-	¹ H-NMR (CDC1 ₃) δ:
	9.16	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	Cı	droisoxa-	8,12 (1H);
					zo1-3-yl	7,98 (1H); 4,60 (1H);
						3,98 (3H); 3,42 (2H);
10						3,25 (3Н)
ſ	9.17	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	Cl	5-Methyl-1,	102-105
					2,4-oxadiaz ol-3-yl	
	0.10	Mark basses	CO C!!	Cl		-H-NMR(CDCl ₃) δ:
	9.18	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	Cı	oxazol-2-yl	*
15						7,98 (1H); 4,57 (2H);
1				İ		4,12 (2H); 3,98 (3H);
	9.19	ОН	-SO ₂ CH ₃	Cl	•	1 H-NMR(CDC1 ₃) δ :
						(9,29 (1H);
	1					8,02 (1H); 7,67 (2H); 6,59 (1H); 2,83 (3H);
20	2 22		00 011	Cl	3.Thienyl	-H-NMR (CDCl ₃) δ:
	9.20	Methoxy	-SO ₂ CH ₃	CI		18,23 (1H);
						'7,84 (1H); 7,49 (2H);
				İ		[7,13 (1H); 3,98 (3H);
25						(2,62 (3H)
45	9.21	ОН	-SO ₂ CH ₃	·	-3-Furyl	200-202
	9.22	ОН	-SO ₂ CH ₃	Cl	5-Methyl-4-	1200-204
				1	phenyl- thiazol-2-y	1
	4	·			- -	t
!	I	I		I	l	

C) Herstellung der Endprodukte

2-[3-(3-Isopropylisoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-ben-zoyl]-cylohexan-1,3-dior (Bsp.-Nr. 1.1232)

35

40

a. 8 g (25 mmol) 3-(3-Isopropylisoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäuremethylester (Beisp. B.1.) werden
in 50 ml Methanol gelöst und mit 1,5 g (37 mmol) NaOH
versetzt. Die Losung wird 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird das Reaktionsgemisch
eingeengt, der Euckstand in Wasser aufgenommen und
mit Salzsäure angesäuert. Nach längerem Rühren bilden
sich hellgelbe Kristalle. Der Feststoff wird abgesaugt und getrocknet.

15

20

25

30

Man erhält 6,6 g (86% d.Th.) 3-(3-Isopropylisoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäure, Fp.: 176-178 °C.

6 g (19 mmol) 3-(3-Isopropylisoxazol-5-yl)-4-methylb. 5 sulfonyl-benzoesäure werden in 60 ml Toluol gelöst, mit einem Tropfen Dimethylformamid versetzt und 3,2 g (27 mmol) Thionylchlorid zugegeben. Nach 4 Stunden Refluxieren wird das Reaktionsgemisch eingeengt.

> Man erhält 6,3 g (99 % d.Th.) 3-(3-Isopropy1isoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäurechlorid, Fp.: 102-105°C.

Zu einer Suspension von 0.5 g (4,6 mmol) Cyclohexac. dion-1,3 in 30 ml Dichlormethan gibt man 0,56 g (5,5 mmol) Triethylamin und tropft anschließend bei 25°C eine Lösung von 1,5 g (4,6 mml) 3-(3-Iso-propylisoxazol-5-yl)-4-methylsulfonyl-benzoesäurechlorid in 20 m Dichlormethan zu. Anschließend wird 12 Stunden bei 40°C gerührt. Nach dem Abkühlen wird mit Wasser verdünnt, die Dichlormethanphase abgetrennt über Magnesiumsulfat getrocknet und eingeengt. Der verbleibende Rückstand wird in 30 ml Acetonitril gelöst, mit 2,8 g Triethylamin und dann mit 0,15 g Acetoncyanhydrin versetzt und 12 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wird der Reaktionsansatz eingeengt, der Rückstand in Essigester aufgenommen und mit verdünnter Salzsäure extrahiert. Nach zweimaligem Waschen mit Wasser wird die organische Phase mit 5%iger Kaliumcarbonatlösung extrahiert. Die wäßrige Phase wird auf pH 6 eingestellt und mit Essigester rückextrahiert. Nach Trocknen und Einengen erhält man 0.51 g (28 % d.Th.) 2-[3-(3-Isopropylisoxazol-5-yl)]-4-methylsulfonyl-benzoyl]-cylohexan-35 1,3-dion, Fp.: 95-98 °C.

In analoger Weise werden die in den nachfolgenden Tabellen aufgeführten Verbindungen erhalten:

45

27	·
Σ-{	
>={	_
ĕ_ ∕	
	~

Id

			11	2									3
FP [OC]	95-98	103-105	112-115	177	86-98	186	89-91	96-56	101-106	172	180	84-86	
2	3-Isopropylisoxazol-5yl	2-Thiazolyl	2-Thiazolyl	2-Thiazolyl	3-Isoxazolyl	3-Isoxazolyl	5-0xazolyl	5-0xazolyl	5-0xazolyl	2-Thiazolyl	2-Thiazolyl	2-Thiazolyl	
Σ	Н	Cl	CΙ	Cl	CI	C1	C1	Cl	C1	C1	c1	CI	
L	-SO;Me	-SO,Et	-SO ₂ Et	-SO₂Me	-SO;Me	-SO₂Me	-SO₂Me	–SO₂Me	–SO₂Me	-SO₂CH₁	-SO,CH₁	-S0,CH;	
χ.	æ	H	Ξ	æ	æ	Ħ	Н	E	王	Ŧ	Н	×	
R ⁴	н	Methyl	H	H	H	H	Œ	H	Methyl	CH ₃	H	×	
R³	Ŧ	Methyl	н	×	н	Methyl	H	Methyl	Methyl	CH ₃	CH3	(Dimeth- oxv)-methyl	
Nr.	10.1	10.2	10.3	10.4	10.5	10.11	10.12	10.13	10.14	10.15	10.16	10.17	

Tabelle 10

		-									11	3									
FP[°C]	110	104	79-82	17-80	75-79	110	102-104	102-105	230	175-180	162-172	204-205	115-120	100-110	127-130	178-180	65-68	81-84	157-161	149-153	73-77
2	2-Thienyl	2-Thienyl	2-Furyl	2-Thienyl	2-Furyl	4-Methylthiazol-2-yl	5-Chlor-4-methylthiazol-2-yl	3-Isoxazoly	4,5-Dihydroisoxazol-3-yl	5-Cyclopropylisoxazol-3-yl	5-Cyclopropylisoxazol-3-yl	4,5-Dihydroisoxazol-3-yl	4,5-Dihydroisoxazol-3-yl	5Cyclopropylisoxazol-3-yl	3-Isoxazolyl	4,5-Dihydroisoxazol-3-yl	2-Furyl	2-Thienyl	2-Thienyl	3-Furyl	3-Thienyl
Σ	C1	C1	Н	CH 3	CH3	C1	C1	C1	CI	CΙ	C1	C1	13	13	C1	C1	Н	Н	Н	C1	CJ
Ţ	-SO ₂ CH ₃	−SO ₂ CH ₃	-SO ₂ CH ₃	-SO ₂ CH ₃	-502СН 3	-SO ₂ CH 3	−SO ₂ CH₃	-SO ₂ CH ₃	-SO₂CH₃	-SO ₂ CH ₃	-SO ₂ CH ₃	-SO ₂ CH ₃	-SO ₂ CH ₃	-SO ₂ CH ₃	-SO₂CH₃	-so ₂ cH ₃	-SO,CH3	-SO ₂ CH ₃	-SO ₂ CH ₃	-SO ₂ CH ₃	-SO ₂ CH ₃
R ⁵	¥	æ	Œ	æ	Œ	Н	Н	Н	Н	Ŧ	Ξ	Ŧ	æ	H	Œ	H	Н	Ξ	Ξ.	=	Ξ
R4	н	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH3	CH ₃	CH ;	CH.	X	Ξ	H	H	CH ₃	CH3	H	н	Ŧ	CH3	н	СН3	сн,
R ³	Ŧ	CH ₃	CH ₃	CH ₃	CH3	CH3	СН;	CH;	н	H	CH3	СН3	СН3	CH ₃	iso-Propyl	iso-Propyl	H	CH ₃	=	CH 3	CH,
Nr.	10.18	10.19	10.20	10.21	10.22	10.23	10.24	10.25	10.26	10.27	10.28	10.29	10.30	10.31	10.32	10.33	10.34	10.35	10.36	10.37	10.38

Nr.	R³	R4	R ⁵	L	Σ	z	FP [oC]
10.39	СН3	СН3	Н	-SO ₂ CH ₃	Н	3-Furyl	100-104
10.40	Н	Н	Н	- SO ₂ CH ₃	Н	3-Furyl	64-68
10.41	СН3	СН3	Н	-SO ₂ CH ₃	C1	5-Methyl-4-phenylthiazol-2-yl	173

•	-	1
•	-	1
	q	υ
,	_	4
•	-	1
	0	U
	Ċ	2
	ſ	
1	٠	

Nr.	R	ĸ.	'n	Γ	Σ	2	FP[°C]
							bzw. ¹ H- NMR
11.1	CH.	CH.	CH=CH	-SO,CH;	C1	2-Thiazolyl	82
11.2	CH.	CH,	CH,-CH;	-SO₂CH₃	c1	2-Thiazolyl	254-256
11.3	CH ₃	CH3	CH2-CH2	-SO₂CH₃	C1	4,5-Dihydroxazol-3-yl	161-163
11.4	CH ₃	CH3	CH2-CH2	-SO₂CH₃	C1	3-Isoxazolyl	125-130

ij

Patentansprüche

1. Benzoylderivate der Formel I

5

10

in der die Substituenten folgende Bedeutungen haben:

L,M Wasserstoff, C:-C6-Alkyl, C2-C6-Alkenyl, C2-C6-Alkinyl,

C:-C:-Alkoxy, wobei diese Gruppen gegebenenfalls durch
ein bis fünf Halogenatome oder C:-C2-Alkoxy substituiert
sein können, Halogen, Cyano, Nitro, eine Gruppe
-(Y):-S(O)-R oder eine Gruppe -(Y):-CO-R8;

ein 5- oder 6-gliedriger heterocyclischer, gesättigter 20 oder ungesättigter Rest, enthaltend ein bis drei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, der gegebenenfalls durch Halogen, Syano, Nitro, eine Gruppe -CO-R8, C:-C4-Alkyl, C:-C4-Halogenalkyl, C3-C8-Cycloalkyl, C1-C4-Alkoxy, C1-C4-Halogen-25 alkoxy, C:-C:-Alkylthio, C:-C:-Halogenalkylthio, Di-C;-C;-Alkylamino, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C:-C4-Alkyl oder C:-C4-Halogenalkyl substituiertes Phenyl oder eine Oxogruppe, die gegebenenfalls auch in der tautomeren Form als Hydroxygruppe vorliegen kann, 30 substituiert ist oder der mit einem ankondensierten, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C;-C4-Alkyl oder C:-C:-Halogenalkyl substituierten Phenylring, einem ankondensierten Carbocyclus oder einem ankondensierten, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C:-C:-Aikyl, 35 Di-C:-C4-Alkylamino, C:-C4-Alkoxy, C:-C4-Halogenalkoxy, oder C:-C:-Halogenalkyl substituierten zweiten Heterocyclus ein bicyclisches System bildet;

40 Y O, NR^9 ;

n null oder eins;

m null, eins oder zwei;

 R^{-} C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl oder $NR^{9}R^{10}$;

R^g C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Alkoxy, oder NR⁹R¹⁰;

45 R⁹ Wasserstoff oder C₁-C₄-Alkyl;

R10 C.-Ca-Alkyl;

Q ein in 2-Stellung verknüpfter Cyclohexan-1,3-dionring der Formel II

in welcher

R: R R und R Wasserstoff oder C:-C4-Alkyl bedeuten,

R* Wasserstoff, C:-C4-Alkyl oder eine Gruppe -COOR:0 bedeutet

Wasserstoff, C:-C:-Alkyl, C3-C6-Cycloalkyl bedeutet, wobei diese Gruppen gegebenenfalls einen bis drei der folgenden Substituenten tragen können: Halogen, C:-C4-Alkylthio, oder C:-C:-Alkoxy,

oder

20

15

R Tetrahydropyranyl-3, Tetrahydropyranyl-4 oder Tetrahydrothiopyranyl-3 bedeutet

oder

25

R³ und R³ gemeinsam eine Bindung oder einen drei- bis sechsgliedrigen carbocyclischen Ring bilden

sowie landwirtschaftlich übliche Salze der Verbindungen I.

30

2. Benzoylderivate der Formel Ia

35
$$Q \xrightarrow{M} Z$$
 Ia

in der L für C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl,

C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl,

C₁-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkyl-sulfonyl, Halogen, Nitro oder Cyano und M für Wasserstoff,

C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy,

C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₁-C₄-Halogenalkoxy,

C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro

oder Cyano steht und Q und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

Benzoylderivate der Formel Ib

5

10

in der L und M für C₁-C₆-Alkyl, C₂-C₆-Alkenyl, C₂-C₆-Alkinyl, C₁-C₄-Alkoxy, C₁-C₄-Alkylthio, C₁-C₄-Halogenalkyl, C₂-C₄-Halogenalkoxy, C₁-C₄-Halogenalkylthio, C₁-C₄-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro oder Cyano stehen und Q und Z die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.

- 4. Benzoylderivate der Formel I gemäß Anspruch 1 in der die Reste L bzw. M für Wasserstoff, Methyl, Methoxy, Methylthio, Chlor, Cyano, Methylsulfonyl, Nitro oder Trifluormethyl stehen.
- 5. Verfahren zur Herstellung der Verbindungen der Formel I gemäß

 25 Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man die jeweiligen

 Ausgangsstoffe der Formel II

mit einem Benzoesäurederivat der Formel III

35

40

45

wobei T = Halogen bedeutet und L,M und Z die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben, acyliert und das Acylierungsprodukt in Gegenwart eines Katalysators zu den Verbindungen I umlagert.

- 6. Herbizides Mittel, enthaltend mindestens ein Benzoylderivat der Formel I gemäß Anspruch 1 und übliche inerte Zusatz-stoffe.
- 5 7. Verfahren zur Bekämpfung unerwünschten Pflanzenwuchses, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge eines Benzoylderivates der Formel 1 gemäß Anspruch 1 auf die Pflanzen oder deren Lebensraum einwirken läßt.
- 10 8. Benzoesäurederivate der Formel III

in der T die folgende Bedeutung hat:

- T Halogen, OH oder C:-C-Alkoxy
 und L, M und Z die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben.
- Benzoylderivate der Formel IIIa

$$T \xrightarrow{\bigcup_{L}} Z$$

X

30

in der T,L,M und Z die folgende Bedeutung haben:

- T Chlor, OH oder C:-C4-Alkoxy
- M C:-C6-Alkyl, C2-C6-Alkenyl, C2-C6-Alkinyl, C:-C4-Alkoxy, C:-C4-Alkylthio, C:-C4-Halogenalkyl, C:-C4-Halogenalkoxy, C:-C4-Halogenalkylthio, C:-C4-Alkylsulfonyl, Halogen, Nitro oder Cyano
 - Z wie in Anspruch 1 angegeben.

10. Benzoylderivate der Formel IIIb

Nitro oder Cyano

6-Ring-Heteroaromat;

Z wie in Anspruch 1 angegeben.

11. Benzoylderivate der Formel I gemäß Anspruch 1, in der Z ein 5- oder 6-gliedriger Heteroaromat bedeutet, enthaltend ein bis drei Heteroatome, ausgewählt aus der Gruppe Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, der gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C:-C:-Alkyl, C:-C:-Halogenalkyl, C:-C:-C:-C-Cyclo-alkyl, C:-C:-Alkoxy, C:-C:-Halogenalkoxy, C:-C:-Alkylthic, C:-C:-Halogenalkylthio, Di-C:-C:-Alkylamino, gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C:-C:-Alkyl oder C:-C:-Halogenalkyl substituiertes Phenyl substituiert ist oder ein gegebenenfalls durch Halogen, Cyano, Nitro, C:-C:-Alkyl oder C:-C:-Halogenalkyl substituierter benzokondensierter 5- oder

und L, M und Q die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben.

35

5

15

40

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inte mai Application No PCT/EP 96/00593

IPC 6	C07D307/54 C07D307/46 C07D263/10 C07D261/08	C07D333/24	C07D333/22	C07D263/32
	CO7D271/06 A01N43/08	A01N43/10	A01N43/28	00/02///20
According t	o International Patent Classification (IPC) or to both	•	•	
	SEARCHED			
Minimum d IPC 6	ocumentation searched (classification system follows CO7D	ed by classification sym	nbols)	
Documentat	on searched other than minimum documentation to	the extent that such do	cuments are included in t	he fields searched
Electronic d	ata base consulted during the international search (na	ame of data base and,	where practical, search te	rms used)
C. DOCUM	ENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT			
Category *	Citation of document, with indication, where appro-	priate, of the relevant	passages	Relevant to claim No.
A	EP,A,O 319 075 (NIPPON SO 1989 cited in the application	DA CO) 7 Jur	ne	1-11
	see abstract; claims see page 15, line 6; exam	ples		e e
A	WO,A,90 05712 (ICI AMERIC	A INC) 31 Má	ау	1-11
	cited in the application see abstract; claims see page 31; example 21;	table 14		
Furt	her documents are listed in the continuation of box C	X	Patent family members	are listed in annex.
* Special cat	tegories of cited documents :	"T" lai	er document published af	ter the international filing date
conside	ent defining the general state of the art which is not ered to be of particular relevance	a	ted to understand the printers.	conflict with the application but iciple or theory underlying the
filing d	document but published on or after the international late int which may throw doubts on priority claim(s) or	e	unnot be considered novel	vance; the claimed invention or cannot be considered to hen the document is taken alone
which citation 'O' docum	is cited to establish the publication date of another n or other special reason (as specified) ent referring to an oral disclosure, use, exhibition or	"Y" de ci d	ncument of particular rele annot be considered to invocument is combined with	vance; the claimed invention volve an inventive step when the i one or more other such docu-
	neans ent published prior to the international filing date but an the priority date claimed	t tr	ents, such combination b the art. ocument member of the si	eing obvious to a person skilled ame patent family
Date of the	actual completion of the international search	D	ate of mailing of the inter	national search report
6	June 1996		14.06.96	
Name and r	nating address of the ISA European Patent Office, P.B. 5818 Patentiaan 2 NL - 2280 HV Riptwijk	""	uthorized officer	
	Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl, Fax: (+31-70) 340-3016		Paisdor, B	

Form PCT/ISA/216 (second sheet) (July 1992)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Inte nal Application No PCT/EP 96/00593

Patent document cited in search report	Publication date	Patent memb		Publication date
EP-A-0319075	07-06-89	AT-T- CA-A- DE-D- JP-A- US-A-	108764 1337818 3850749 2000726 5110343	15-08-94 26-12-95 25-08-94 05-01-90 05-05-92
WO-A-9005712	31-05-90	US-A- AT-T- AU-B- CA-A- CN-B- DE-D- DE-T- EP-A- ES-T- IL-A- JP-T- RU-C- TR-A-	4957538 123752 635725 4743390 2003172 1024187 68923088 68923088 0444152 2073561 92341 4501726 2045512 24909	18-09-90 15-06-95 01-04-93 12-06-90 18-05-90 13-04-94 20-07-95 26-10-95 04-09-91 16-08-95 21-10-94 26-03-92 10-10-95 01-07-92

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Inte: nales Aktenzeichen
PCT/EP 96/00593

					<u></u>
A. KLASS	CO7D263/10 CO7D271/06 CO7D271/06	CO7D307/46 CO7D307/46 CO7D261/08 A01N43/08	CO7D333/24		C07D263/32 C07D277/26
Nach der li	nternationalen Patentklassi	ikation (IPK) oder nach	der nationalen Klassif	kation und der IPK	
	RCHIERTE GEBIETE				
Recherchies IPK 6	ter Mindestprüfstoff (Kla CO7D	ssifikationssystem und Ki	assifikationssymbole)		
				diese unter die recherchiert	
			the Datenbank (Name	der Datenbank und evtl. w	erwendete Suchbegniie)
	ESENTLICH ANGESEH				
Kategorie*	Bezeichnung der Veröffe	ntlichung, soweit erforde	rlich unter Angabe der	in Betracht kommenden To	tale Betr. Anspruch Nr.
A	1989 in der Anme siehe Zusam	075 (NIPPON S ldung erwähnt menfassung; A 15, Zeile 6;	nsprüche	ni	1-11
A	1990 in der Anme siehe Zusam	12 (ICI AMERI ldung erwähnt menfassung; A 31; Beispiel	nsprüche		1-11
	ere Veröffentlichungen sine ihmen	i der Fortsetzung von Fe	id C zu X	Siche Anhang Patentian	ulic
* Besondere 'A' Veröffe aber n 'E' älteres Anmel 'L' Veröffe schenn andere soll od ausgeff 'O' Veröffe eine B 'P' Veröffe dem be	Kategonen von angegeber mitichung, die den allgeme icht als besonders bedeutsa Dokument, das jedoch erst dedatum veröffentlicht wo nithichung, die geeignet ist, in zu lassen, oder durch di ni im Recherchenbericht ge er die aus einem anderen t ihrt) intlichung, die sich auf ein mitichung, die sich auf ein mitichung, die vor dem int eanspruchten Prioritätsdatu	nnen Stand der Technik im anzusehen ist am oder nach dem inter niden ist einen Prioritätsanspruch e das Veröffendichungsdinannten Veröffendlichungsonderen Grund angeg e mündliche Offenbarun oder andere Maßnahmermationalen Armeldedaim veröffentlicht worden	definiert, A nationalen T zweifelhaft er- atum einer ei g belegt werden vy v chen ist (wie h n bezieht aum, aber nach ist	der dem Prioritätsdatum ver nmeldung nicht kollidiert, in rfindung zugrundeliegender heone angegeben ist eröffentlichung von besond um allein aufgrund dieser Vi- findenscher Tätigkeit beruf- eröffentlichung von besond um nicht als auf erfindens erden, wenn die Veröffentli- eröffentlichungen dieser K- ese Verbindung für einen I eröffentlichung, die Mitglie	erer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung cher Tätigkeit berühend betrachtet schung mit einer oder mehreren anderen ategorie in Verbindung gebracht wird und Fachmann naheliegend ist ed derselben Patentfamilie ist
	Abschlusses der internstion . Juni 1996	alen Recherche	^	14. 06. 96	onaien Recherchenberichts
Name und 1	Postanschrift der Internano Europäisches Patentana NL - 2280 HV Rijswi Td. (+31-70) 340-204 Fax: (+31-70) 340-30	nt, P.B. 5818 Patentiaan ik 0, Tx. 31 651 epo n.J.		evoltmächtigter Bedienstete Paisdor, B	т

Formblett PCT/ISA/210 (Blatt 2) (Juli 1992)

INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Inte: males Aktenzeichen
PCT/EP 96/00593

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied Patenti		Datum der Veröffentlichung
EP-A-0319075	07-06-89	AT-T- CA-A- DE-D- JP-A- US-A-	108764 1337818 3850749 2000726 5110343	15-08-94 26-12-95 25-08-94 05-01-90 05-05-92
WO-A-9005712	31-05-90	US-A- AT-T- AU-B- AU-B- CA-A- CN-B- DE-D- DE-T- EP-A- ES-T- IL-A- JP-T- RU-C- TR-A-	4957538 123752 635725 4743390 2003172 1024187 68923088 68923088 0444152 2073561 92341 4501726 2045512 24909	18-09-90 15-06-95 01-04-93 12-06-90 18-05-90 13-04-94 20-07-95 26-10-95 04-09-91 16-08-95 21-10-94 26-03-92 10-10-95 01-07-92